

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
7. November 2002 (07.11.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/088126 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 487/04**,
A01N 43/90

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/04287

(22) Internationales Anmeldedatum:
18. April 2002 (18.04.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
101 21 162.7 30. April 2001 (30.04.2001) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): **BAYER AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE];
51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **GEBAUER, Olaf**
[DE/DE]; Jesuitengasse 111, 50737 Köln (DE). **GREUL,**
Jörg, Nico [DE/DE]; Am Sandberg 30a, 42799 Le-
ichlingen (DE). **HEINEMANN, Ulrich** [DE/DE]; Am
Sonnenhang 1, 42799 Leichlingen (DE). **ELBE, Hans,**
Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE).
KRÜGER, Bernd, Wieland [DE/DE]; Am Vorend
52, 51467 Bergisch Gladbach (DE). **MAURER, Fritz**
[DE/DE]; Brahmstr. 36, 40789 Monheim (DE). **DUNKEL,**
Ralf [DE/DE]; Krischerstr. 22, 40789 Monheim (DE).
VOERSTE, Arnd [DE/DE]; Salierring 33, 50677 Köln
(DE). **EBBERT, Ronald** [DE/DE]; Hütendorfer Str. 305,

51371 Leverkusen (DE). **WACHENDORFF-NEU-**
MANN, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566
Neuwied (DE). **KITAGAWA, Yoshinori** [JP/JP]; P.O. Box
157, Tokyo, Tokyo 103-91 (JP). **MAULER-MACHNIK,**
Astrid [DE/DE]; Neuenkamper Weg 48, 42799 Leichlin-
gen (DE). **KUCK, Karl, Heinz** [DE/DE]; Pastor-Löh-Str.
30a, 40764 Langenfeld (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER AKTIENGE-**
SELLSCHAFT; 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,
SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,
US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

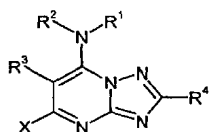
Erklärung gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die
folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,

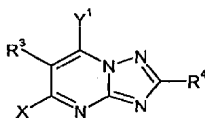
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: TRIAZOLOPYRIMIDINES

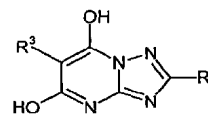
(54) Bezeichnung: TRIAZOLOPYRIMIDINE



(I)



(II)



(V)

(57) **Abstract:** The invention relates to novel triazolopyrimidines of formula (I), wherein R¹, R², R³, R⁴ and X have the meanings as cited in the description. The invention also relates to a plurality of methods for producing said novel substances and the uses thereof for combating undesired micro-organisms, novel intermediate products of formulae (II), (V) and a method for the production thereof, as well as novel amines and carbamates which have the formula as cited in the description and a method for the production thereof.

(57) **Zusammenfassung:** Neue Triazolopyrimidine der Formel (I), in welcher R¹, R², R³, R⁴ und X die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zur Herstellung dieser neuen Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen. Neue Zwischenprodukte der Formeln (II), (V) sowie Verfahren zu deren Herstellung. Außerdem auch neue Amine und Carbamate der in der Beschreibung angegebenen Formeln sowie Verfahren zu deren Herstellung.



WO 02/088126 A1



CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

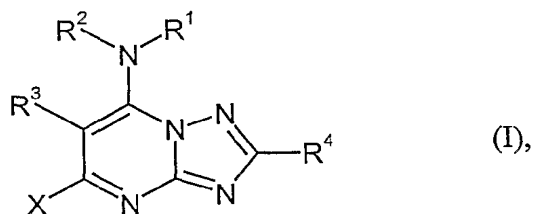
- 1 -

Triazolopyrimidine

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Triazolopyrimidine, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen. Die Erfindung betrifft außerdem neue Zwischenprodukte sowie Verfahren zu deren Herstellung.

Es ist bereits bekannt geworden, dass bestimmte Triazolopyrimidine fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. EP-A 0 550 113, WO 94-20 501, EP-A 0 613 900, US-A 5 612 345, EP-A 0 834 513, WO 98-46 607 und WO 98-46 608). Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber bei niedrigen Aufwandmengen in manchen Fällen zu wünschen übrig.

Es wurden nun neue Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

R¹ für Amino, Hydroxy, für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Alkenyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkinyloxy, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkylamino, gegebenenfalls substituiertes Dialkylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkenylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkynylamino, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkylamino, gegebenenfalls substituiertes N-

- 2 -

Cycloalkyl-N-alkyl-amino, gegebenenfalls substituiertes Alkylidenamino, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl oder für einen Rest der Formel -S-R⁵ steht, worin

5 R⁵ für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht,

10 R² für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht,

oder

15 R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen,

 R³ für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Aryl steht,

20 R⁴ für gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder für gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht und

 X für Halogen steht,

25 sowie Säure-Additionssalze von denjenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

 R¹ für Amino steht,

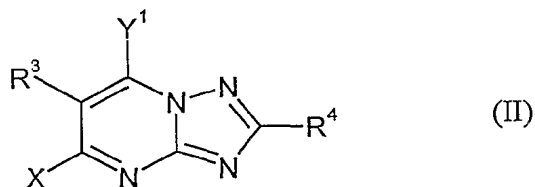
gefunden.

- 3 -

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können je nach Substitutionsmuster gegebenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z.B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen. Ist R³ an beiden Atomen, die der Bindungsstelle benachbart sind, ungleich substituiert, können die betreffenden Verbindungen in einer besonderen Form der Stereoisometrie, als Atropisomere, vorliegen.

Weiterhin wurde gefunden, dass sich Triazolopyrimidine der Formel (I) herstellen lassen, indem man

a) Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel

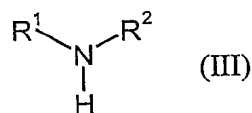


in welcher

R³, R⁴ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y¹ für Halogen steht,

mit Aminen der Formel



in welcher

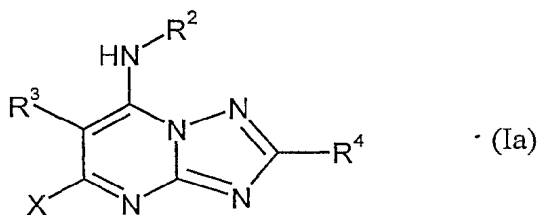
R¹ und R² die oben angegebenen Bedeutungen haben,

- 4 -

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umgesetzt,

5 oder

b) Triazolopyrimidine der Formel



10 in welcher

R^2 , R^3 , R^4 und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Sulfensäurehalogeniden der Formel

15



in welcher

R^5 die oben angegebenen Bedeutungen hat und

20

Y^2 für Halogen steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umgesetzt,

25

und gegebenenfalls an die so erhaltenen Verbindungen der Formel (I), in denen

- 5 -

R¹ für Amino steht,

eine Säure addiert.

5

Schließlich wurde gefunden, dass sich die neuen Triazolopyrimidine der Formel (I) bzw. deren Säureadditions-Salze sehr gut zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen eignen. Sie zeigen vor allem eine starke fungizide Wirksamkeit und lassen sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwenden.

10

Überraschenderweise besitzen die erfindungsgemäßen Triazolopyrimidine der Formel (I) eine wesentlich bessere mikrobizide Wirksamkeit als die konstitutionell ähnlichsten, vorbekannten Stoffe gleicher Wirkungsrichtung.

15

R¹ steht bevorzugt für Hydroxy, Amino, für gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Hydroxy, Amino, Phenyl, Heterocyclyl, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Dialkylamino mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Halogenycycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Oxo, Hydroxyimino und/oder Alkoximino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen,

20

25

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkynyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

- 6 -

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Halogenalkyl mit 1 bis 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,

5 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkoxy mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

10

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkinyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

15

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkylamino mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen,

20

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Dialkylamino mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen in jedem der Alkylreste,

25

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenylamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkinylamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

- 7 -

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes N-Alkyl-N-Alkenylamino mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil und 2 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkenylteil,

5 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkylamino mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,

10 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes N-Cycloalkyl-N-alkyl-amino mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil und 1 bis 7 Kohlenstoffatomen in Alkylteil,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkylidenamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

15 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Phenyl,

für gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Heterocyclyl mit 5 oder 6 Ringgliedern,

20 für gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Heterocycloxy mit 5 oder 6 Ringgliedern,

für -SR⁵, worin

25 R⁵ für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen,

- 8 -

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

5 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkinyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder

10 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht,

wobei die zuvor genannten Heterocyclyl-Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch

15 Halogen, Hydroxy, Phenyl, 1,2-Dioxyethylen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Halogenalkylthio mit
20 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen und wobei die zuvor genannten Heterocyclylreste gesättigt oder teilweise ungesättigt sind,

25 und wobei die zuvor genannten Phenyl-Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

30

- 9 -

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

5 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

10 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

15 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

20 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,

25 in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylenedioxy (-O-CH₂-O-), 1,2-Ethylendioxy (-O-CH₂-CH₂-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen.

30

- 10 -

R² steht bevorzugt für Wasserstoff,

5 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen
Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoff-
atomen, Oxo, Hydroximino und/oder Alkoximino mit 1 bis 4 Kohlenstoff-
atomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

10 für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlen-
stoffatomen substituiertes Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlen-
stoffatomen substituiertes Alkynyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder

15 für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlen-
stoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

R¹ und R² stehen bevorzugt gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden
sind, für einen 3- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Ring, der gesättigt oder
teilweise gesättigt ist, der neben dem bereits erwähnten Stickstoffatom noch
20 ein weiteres Heteroatom aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel
enthalten kann und der einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden
substituiert sein kann durch

Halogen, Hydroxy, Cyano, Morpholinyl, Amino, einen annelierten Phenyl-
ring, eine Methylen- oder Ethylenbrücke,

25 Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder
verschiedenen Halogenatomen;

Alkylcarbonalamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

Dialkylamino mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen,

30 Alkoxy-carbonylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

- 11 -

Di(alkoxycarbonyl)amino mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen,
Hydroxyalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,
Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder
Alkylcarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

5

R³ steht bevorzugt für Phenyl, das einfach bis vierfach, gleichartig oder
verschieden substituiert sein kann durch

10

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thio-
carbamoyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkyl-
sulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

15

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2
bis 6 Kohlenstoffatomen;

20

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halo-
genalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1
bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogen-
atomen;

25

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyl-
oxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 11 gleichen oder ver-
schiedenen Halogenatomen;

30

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkyl-
carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximi-
noalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den
einzelnen Alkylteilen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,

5 in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylendioxy (-O-CH₂-O-), 1,2-Ethylendioxy (-O-CH₂-CH₂-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen.

10

R⁴ steht bevorzugt für gegebenenfalls durch 1 bis 9 Halogenatome substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch 1 bis 9 Halogenatome substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

15

X steht bevorzugt für Fluor, Chlor oder Brom.

20

R¹ steht besonders bevorzugt für Hydroxy, Amino, für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxymethyl, 2-Methoxy-ethyl, Methylthiomethyl, 2-Methylthio-ethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl, Acetylmethyl, 2-Hydroximino-propyl, 2-Methoximino-propyl, Allyl, 2-Methylprop-2-enyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(Trifluormethyl)-ethyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl,

25

Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Difluor-methoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy,

30

Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Trifluorethylamino, Cyclohexylmethylamino, 2-Cyanethylamino, Allylamino, 1-Cyclopropylethylamino, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, 1-Me-

- 13 -

thylethylidenamino, Phenyl, Benzyloxy, Piperidinyl, Morpholinyl, Pyridyl-methoxy, Thiazolylmethoxy, oder für $-S-R^5$, worin

5 R^5 für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Difluormethyl, Difluorchlor-methyl, Dichlorfluormethyl oder Trifluormethyl steht,

oder

10 R^1 steht für (2,2-Dichlorcyclopropyl)methyl, (2-Furyl)methyl, (2-Tetrahydro-furyl)methyl, (2-Tetrahydropyranyl)methyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,3-Dioxo-lan-2-ylmethyl, 1-Cyclopropylethyl, 1-Cyclopropylethylamino, 1-Methyl-ethylidenamino, 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl, 2,4-Dichlorbenzyloxy, 2,6-Dichlorbenzyloxy, 2-Butyl, 2-Chlorbenzyloxy, 2-Fluorcyclopropyl, 2-Hexa-hydropyranyloxy, 2-Methoxyethyl, 2-Thienylmethyl, 2-Tolyl, 2-Trifluor-methylcyclohexyl, 3-(Dimethylamino)-propyl, 3,5-bis-Trifluormethylcyclo-hexyl, 3,5-Dichlorbenzyloxy, 3-Aminopropyl, 3-Chlorbenzyloxy, 3-Tolyl, 3-Trifluormethylbenzyloxy, 3-Trifluormethylcyclohexyl, 3,5-(Bis-trifluorme-thyl)-cyclohexyl, 2-Trifluormethyl-cyclohexyl, 4-Trifluormethyl-cyclohexyl, 4-Chlorbenzyloxy, 4-Fluorbenzyloxy, 4-Fluorphenyl, 4-Tolyl, 4-Trifluor-methylbenzyloxy, 4-Trifluormethylcyclohexyl, Allyl, Allylamino, Allyloxy, Benzyloxy, $-C(CH_3)_2-CF_3$, $-C(CH_3)_2-CH_2-COCH_3$, $-C_2H_5$, $-CH(CH_2OH)-COOCH_3$, $-CH(CH_3)-C(CH_3)_3$, $-CH(CH_3)-CH(O-CH_3)_2$, $-CH(CH_3)-CH=CH_2$, $-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)_2$, $-CH(CH_3)-CH_2-O-CH_3$, $-CH(CH_3)-CH_2-OH$, $-CH(CH_3)-COOCH_3$, $-CH(CH_3)-COO-t-butyl$, $-CH_2-C(CH_3)=CH_2$, $-CH_2-C(CH_3)_3$, $-CH_2-CF_3$, $-CH_2-CH(OCH_3)_2$, $-CH_2-CH_2-CF_3$, $-CH_2-CH_2-Cl$, $-CH_2-CH_2-CN$, $-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$, $-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$, $-CH_2-CH_2-NH_2$, $-CH_2-CHF_2$, $-CH_2-CN$, $-CH_2-COOC_2H_5$, $-CH_2-COOC_2H_5$, $-CH_2-COOCH_3$, $-CH_3$, Cyclohexyl, Cyclopentyl, Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Dimethylamino, i-Butoxy, i-Butyl, i-Propylamino, n-Butoxy, n-Butyl, n-Butylamino, $-NH_2$, $-NH-CH_2-CF_2-CHF_2$, $-NH-CH_2-$

15

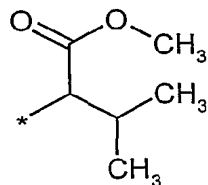
20

25

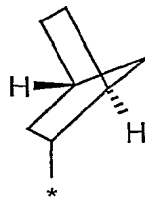
30

- 14 -

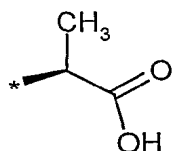
CF₃, -NH-CH₂-CH(CH₃)₂, -O-C₂H₅, -O-CH(CH₃)-CH₂-CH₃, -O-CH₃, -OH, O-i-Propyl, Propargyl, t-Butoxy, t-Butyl, t-Butylamino, oder für eine Gruppierung



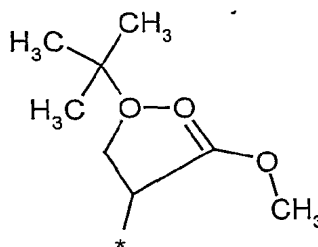
AB3



AB30



AB33



AB5

5

(* markiert jeweils die Bindungsstelle)

10

wobei die zuvor genannten Thiazolyl- und Pyridyl-Reste im Falle von Thiazolyl einfach oder zweifach und im Falle von Pyridyl einfach bis dreifach, jeweils gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Dichlorfluormethylthio, Trifluormethylthio und/oder Phenyl,

15

- 15 -

und wobei die zuvor genannten Phenyl- und Benzyloxy-Reste im Phenylteil einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch

5 Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, 10 Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, Methylendioxy (-O-CH₂-O-), 1,2-Ethylendioxy (-O-CH₂-CH₂-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, 20 gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Trifluormethyl.

R² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxymethyl, 2-Methoxy-ethyl, Methylthiomethyl, 2-Methylthio-ethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl, Acetylmethyl, 2-Hydroxyimino-propyl, 2-Methoxyimino-propyl, Allyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(1,1,1-Trifluormethyl)ethyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl. 25

- 16 -

R¹ und R² stehen besonders bevorzugt gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an welches sie gebunden sind, für 1-Pyrrolinyl, 3-Pyrrolinyl, Pyrrolidinyl, Dihydropyridinyl, Piperidinyl, Pyrazolinyl, Pyrazolidinyl, Imidazolinyl, Imidiazolidinyl, 1,2-Diazinan-yl, 1,3-Diazinan-yl, Piperazinyl, Oxazolinyl, Oxazolidinyl, Isoxazolyl, Isoxazolidinyl, Dihydrooxazinyl, Morpholinyl, Thiazolinyl, Thiazolidinyl, Thiomorpholinyl, wobei die genannten Heterocyclen substituiert sein können durch

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxa, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximinomethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, durch einen annelierten Phenylring oder durch eine Methandiyl- oder Ethandiyl-Brücke.

R³ steht besonders bevorzugt für Phenyl, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl,

- 17 -

5 Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluorethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

10 in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, Methylendioxy (-O-CH₂-O-), 1,2-Ethylendioxy (-O-CH₂-CH₂-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Trifluormethyl.

15 R⁴ steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl oder Cyclopropyl.

X steht besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

20

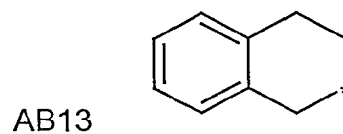
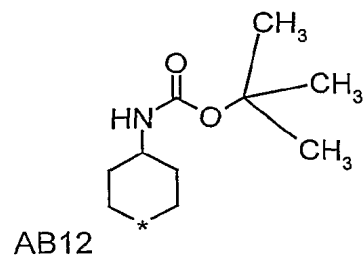
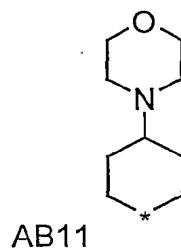
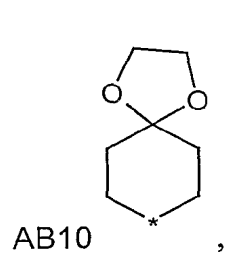
R¹ und R² stehen ganz besonders bevorzugt gemeinsam für eine der folgenden Gruppierungen

-CH(CF₃)-CH₂-CH₂-CH₂-, -CH(CF₃)-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-,
 -CH(CH₃)-CH=CH-CH(CH₃)-, -CH(CH₃)-CH₂-CH₂-O-,
 25 -CH(COOCH₃)-, -CH₂-CH(CH₃)-CH₂-CH(CH₃)-CH₂-,
 -CH₂-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)-CH₂-, -CH₂-CH(NH₂)-CH₂-CH₂-
 CH₂-C-CH₂-CH(OH)-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH(OH)-CH₂-CH₂-CH₂-
 -CH₂-CH=C(C₂H₅)-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-C(CH₃)₂-CH₂-CH₂-
 -CH₂-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH(CF₃)-CH₂-CH₂-

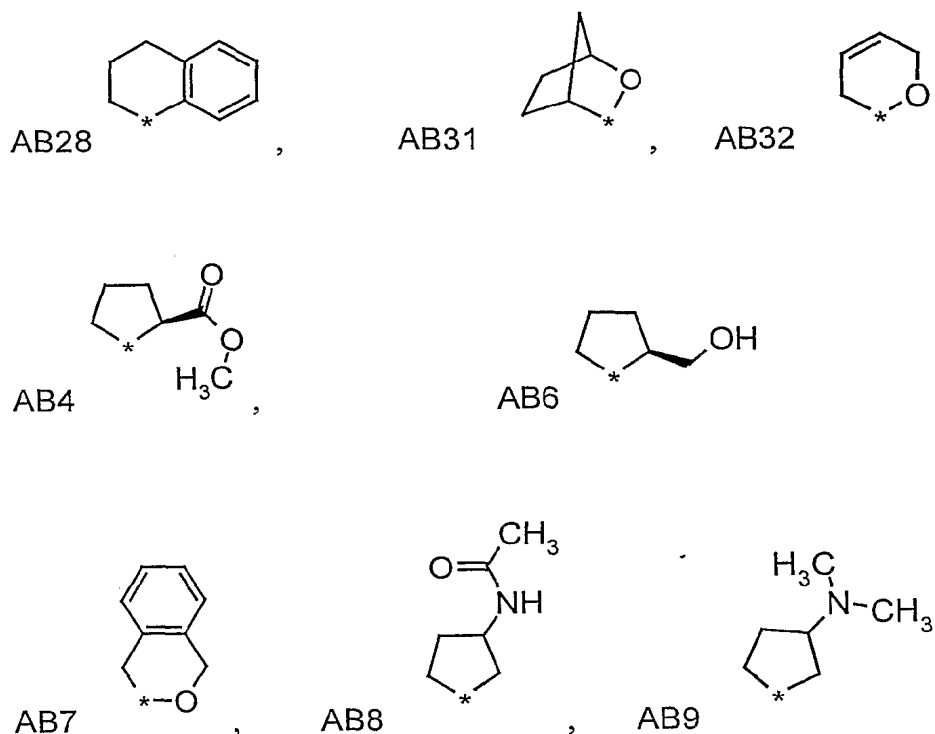
- 18 -

-CH₂-CH₂-CH(CH₃)-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH(CH₃)-CH₂-CH₂-
 -CH₂-CH₂-CH(COCH₃)-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH(COOCH₃)-CH₂-CH₂-
 -CH₂-CH₂-CH(NH-COCH₃)-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH(OH)-CH₂-CH₂-
 -CH₂-CH₂-CH=C(CH₃)-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH=CH-CH₂-
 5 -CH₂-CH₂-CH₂-CH(CH₃)-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH(CH₃)-CH₂-
 -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH(CH₃)-
 -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CHBr-CH₂-CH₂-
 -CH₂-CH₂-CHF-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-N(CH₃)-CH₂-CH₂-
 -CH₂-CH₂-O-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-S-CH₂-CH₂-
 10 -CH₂-S-CH₂-CH₂-, -NH-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-
 -O-CH₂-CH₂-CH₂-CH(CH₃)-, -O-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-,

oder für eine der folgenden Gruppierungen, in denen X₂ für das Stickstoffatom steht, an welches die Reste R¹, R² gebunden sind



- 19 -



(* markiert jeweils die Bindungsstelle)

10 R^2 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-, i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl.

15 R^3 steht ganz besonders bevorzugt für Phenyl, welches einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor und/oder Chlor in den Positionen 2, 4 und 6 substituiert ist.

X steht ganz besonders bevorzugt für Chlor.

- 20 -

Ganz besonders bevorzugt sind weiterhin diejenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

R¹, R², R⁴ und X die zuvor genannten bevorzugten Bedeutungen haben und

R³ für 2,4-disubstituiertes, 2,6-disubstituiertes oder 2,4,6-trisubstituiertes Phenyl steht.

5

Ganz besonders bevorzugt sind weiterhin diejenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

R¹, R², R⁴ und X die zuvor genannten Bedeutungen haben und

R³ für 2-Chlor-4-fluorphenyl, 2-Chlor-6-fluorphenyl oder 2-Chlor-4,6-difluorphenyl steht.

10

Ganz besonders bevorzugt sind weiterhin diejenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

R¹, R², R³ und X die zuvor genannten Bedeutungen haben und

R⁴ für Cyclopropyl steht.

15

Ganz besonders bevorzugt sind weiterhin diejenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

X, R³ und R⁴ die zuvor genannten Bedeutungen haben und

R¹ für Wasserstoff und

R² für -CH(CH₃)CF₃ steht.

20

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe von Verbindungen sind diejenigen Triazolopyrimidine der Formel (I), in denen

R⁴ für Cyclopropyl steht und

R¹, R², R³ und X die zuvor als bevorzugt genannten Bedeutungen haben.

30

- 21 -

Die zuvor genannten Reste-Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem können auch einzelne Bedeutungen entfallen.

5 Bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen sind auch Additionsprodukte aus Säuren und denjenigen Triazolopyrimidinen der Formel (I), in denen

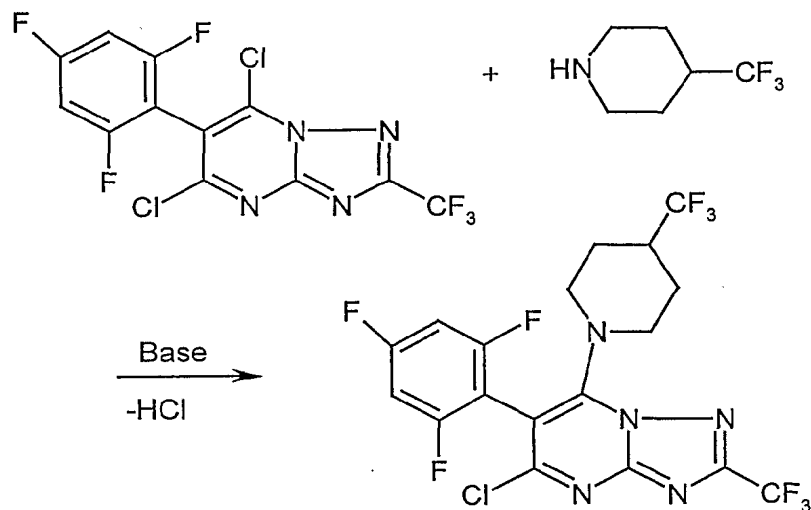
R¹ für Amino steht und

10 R², R³, R⁴ und X diejenigen Bedeutungen haben, die für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

15 Zu den Säuren, die addiert werden können, gehören vorzugsweise Halogenwasserstoffsäuren, wie z.B. die Chlorwasserstoffsäure und die Bromwasserstoffsäure, insbesondere die Chlorwasserstoffsäure, ferner Phosphorsäure, Salpetersäure, mono- und bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren, wie z.B. Essigsäure, Maleinsäure, Bernsteinsäure, Fumarsäure, Weinsäure, Zitronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure und Milchsäure, sowie Sulfonsäuren, wie z.B. p-Toluolsulfonsäure, 1,5-Naphthalindisulfonsäure, Saccharin und Thiosaccharin.

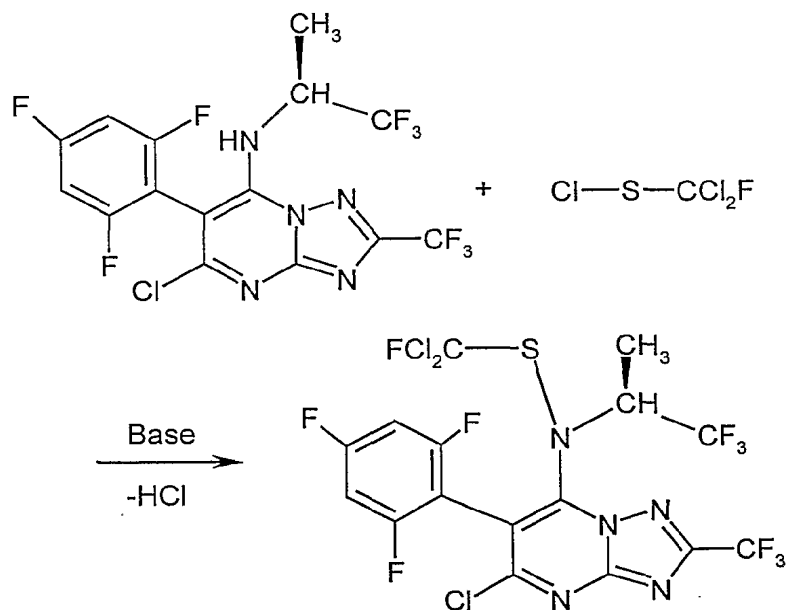
20 Verwendet man 5,7-Dichlor-2-(trifluormethyl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin und 4-Trifluormethylpiperidin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

- 22 -



Verwendet man 5-Chlor-2-(trifluormethyl)-N-[(1S)-2,2,2-trifluor-1-methyl-ethyl]-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]pyrimidin-7-amin und Dichlorfluor-

5 methan-sulfenylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsge-
mäßigen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



10

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Dihalogen-triazolo-pyrimidine sind durch die Formel (II) allgemein defi-

- 23 -

niert. In dieser Formel haben R^3 , R^4 und X vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden. Y^1 steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

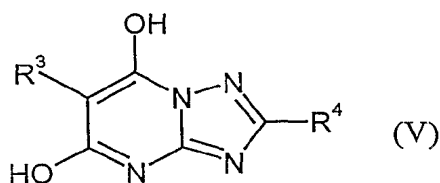
5

Die Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel (II) sind neu. Auch diese Stoffe eignen sich zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

Die Dihalogen-triazolopyrimidine lassen sich herstellen, indem man

10

c) Dihydroxy-triazolo-pyrimidine der Formel



in welcher

15

R^3 und R^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

20

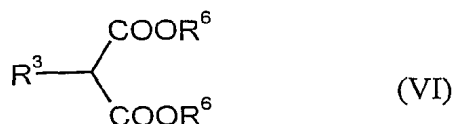
Die bei der Durchführung des Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Dihydroxy-triazolopyrimidine sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel haben R^3 und R^4 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

25

Auch die Dihydroxy-triazolopyrimidine der Formel (V) sind bisher noch nicht bekannt. Sie lassen sich herstellen, indem man

- 24 -

d) Arylmalonester der Formel



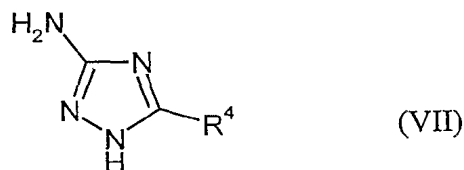
5 in welcher

R^3 die oben angegebenen Bedeutungen hat und

R^6 für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

10

mit Aminotriazolen der Formel



in welcher

15

R^4 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in
Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt.

20

Die bei der Durchführung des Verfahrens (d) als Ausgangsstoffe benötigten Arylmalonester sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel hat R^3 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden. R^6 steht vorzugsweise für Methyl oder Ethyl.

25

- 25 -

Die Arylmalonester der Formel (VI) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen (vgl. US-A 6 156 925).

5 Die bei der Durchführung des Verfahrens (d) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Aminotriazole sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel hat R^4 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden.

10 Die Aminotriazole der Formel (VII) sind bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (vergl. J. Org. Chem. (1974), 39(11), Khim. Geterotsikl. Soedin. (1989), (2), 278 oder Zh. Obshch. Khim. (1969), 39(11)).

15 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (d) alle für derartige Umsetzungen üblichen, inerten organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, i-Propanol, n-Butanol und tert.-Butanol.

20 Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (d) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Tributylamin oder Pyridin. Im Überschuss eingesetztes Amin kann auch als Verdünnungsmittel fungieren.

25 Die Temperaturen können bei der Durchführung des Verfahrens (d) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 50°C und 180°C.

30 Bei der Durchführung des Verfahrens (d) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist allerdings auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des Verfahrens (d) setzt man Arylmalonester der Formel (VI) und Aminotriazol der Formel (VII) im allgemeinen in äquivalenten Mengen um. Es ist aber auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem Überschuss zu verwenden. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Als Halogenierungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (c) alle für den Ersatz von Hydroxygruppen durch Halogen üblichen Komponenten in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Phosphortrichlorid, Phosphortribromid, Phosphor-
pentachlorid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder deren Gemische. Die entsprechenden Fluor-Verbindungen der Formel (II) lassen sich aus den Chlor- oder Brom-Verbindungen durch Umsetzung mit Kaliumfluorid herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (c) alle für derartige Halogenierungen üblichen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind halogenierte aliphatische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol. Als Verdünnungsmittel kann aber auch das Halogenierungsmittel selbst, z.B. Phosphoroxychlorid oder ein Gemisch von Halogenierungsmitteln fungieren.

Die Temperaturen können auch bei der Durchführung des Verfahrens (c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Bei der Durchführung des Verfahrens (c) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem Druck zu arbeiten.

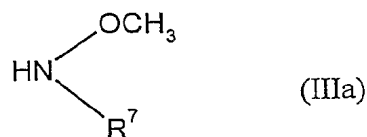
Bei der Durchführung des Verfahrens (d) setzt man Dihydroxy-triazolpyrimidin der Formel (V) im allgemeinen mit einem Überschuss an Halogenierungsmittel um. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

- 27 -

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel haben R^1 und R^2 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für R^1 und R^2 als bevorzugt angegeben wurden.

Die Amine der Formel (III) sind teilweise bekannt.

Neu sind Amine der Formel (IIIa),

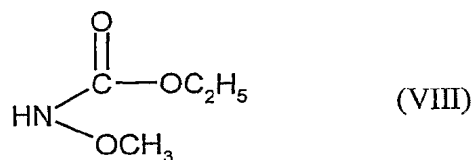


in welcher

R^7 für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für $\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---C=CH}_2 \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$ steht.

Die Amine der Formel (IIIa) lassen sich herstellen, indem man

e) in einer ersten Stufe N-Methoxycarbaminsäure-ethylester der Formel (VIII)



mit Halogenverbindungen der Formel (IX),



in welcher

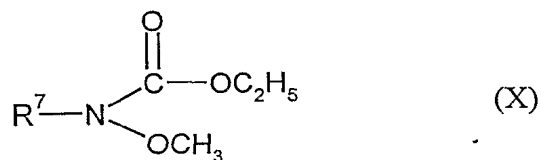
- 28 -

R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X^1 für Brom oder Iod steht,

5

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die entstehenden Carbamate der Formel (X),



10

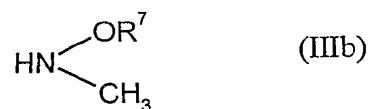
in welcher

R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umgesetzt.

15

Neu sind auch Amine der Formel (IIIb),



20

in welcher

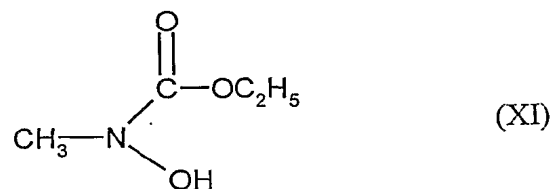
R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat.

Die Amine der Formel (IIIb) lassen sich herstellen, indem man

25

- 29 -

- f) in einer ersten Stufe N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XI),



5 mit Halogenverbindungen der Formel (IX),



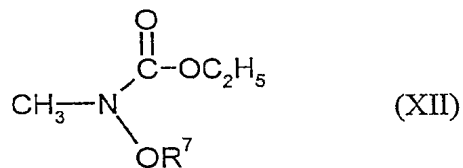
in welcher

10

R^7 und X^1 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die entstehenden Carbamate der Formel (XII),

15



in welcher

R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

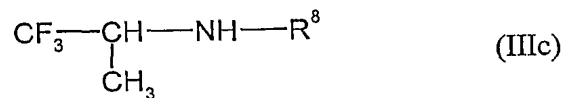
20

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umgesetzt.

Neu sind auch Trifluorisopropylamine der Formel (IIIc),

25

- 30 -



in welcher

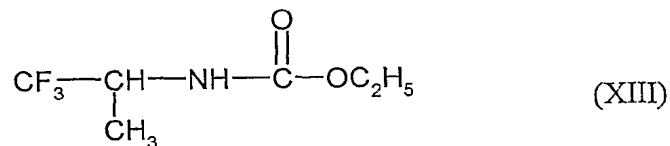
R^8 für Methyl, Ethyl oder Propyl steht.

5

Die Trifluorisopropylamine der Formel (IIIc) lassen sich herstellen, indem man

g) in einer ersten Stufe N-Trifluorisopropyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XIII),

10



mit Halogenverbindungen der Formel (XIV),



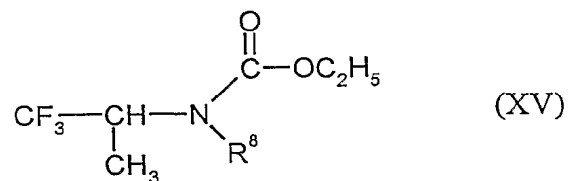
15

in welcher

R^8 und X^1 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die entstehenden Carbamate der Formel (XV),



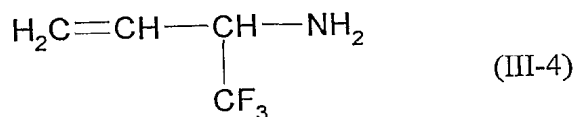
in welcher

- 31 -

R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen hat,

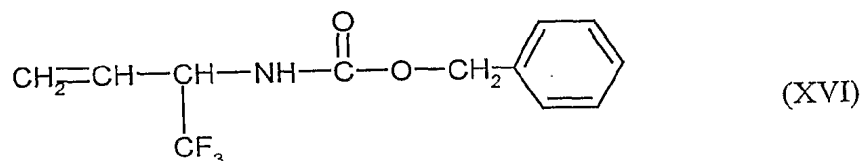
in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umsetzt.

Neu ist schließlich auch das 3-Trifluor-methyl-3-amino-propen der Formel (III-4)



Das 3-Trifluormethyl-3-amino-propen der Formel (III-4) lässt sich herstellen, indem man

h) das Carbamat der Formel (XVI)



mit wässriger Salzsäure umsetzt.

Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (e)-(g) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formeln (VIII), (IX), (XI), (XIII), (XIV) und (XVI) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) kommen jeweils alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Säureakzeptoren in Frage.

Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat und Natriumhydrogencarbonat, und außerdem Ammonium-Verbindungen, wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat und Ammoniumcarbonat. Als organische Basen seien genannt: tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononon (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) jeweils alle üblichen inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Ether, wie Diethylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid oder N-Methylpyrrolidon; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, tert.-Butanol, n-Butanol.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e) (f), und (g) jeweils innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 100°C.

Bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) arbeitet man im allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem Druck oder, sofern keine niedrig siedenden Komponenten an der Umsetzung beteiligt sind, unter vermindertem Druck zu arbeiten.

- 33 -

Bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) setzt man

- 5 • auf 1 mol an N-Methoxy-carbaminsäure-ethylester der Formel (VIII) im Allgemeinen 0,5 bis 1,5 mol, vorzugsweise 1 bis 5 mol an Halogenverbindung der Formel (IX) ein, bzw.
- 10 • auf 1 mol an N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XI) im Allgemeinen 0,5 bis 15 mol, vorzugsweise 1 bis 5 mol an Halogenverbindung der Formel (IX) ein, bzw.
- 15 • auf 1 mol an N-Trifluorisopropyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XIII) im Allgemeinen 0,5 bis 15 mol, vorzugsweise 1 bis 5 mol an Halogenverbindung der Formel (XIV) ein.

Die Aufarbeitung erfolgt jeweils nach üblichen Methoden, beispielsweise durch Extraktion und anschließende Trocknung oder durch Fällung mit anschließender Filtration und Trocknung. Gegebenenfalls noch vorhandene Verunreinigungen können nach üblichen Methoden entfernt werden.

Die bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) als Zwischenprodukte erhaltenen Verbindungen der Formeln (X), (XII) und (XV) sind neu.

Auch bei der Durchführung der zweiten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) können die Reaktionstemperaturen jeweils innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 80°C.

30

- 34 -

Auch bei der Durchführung der zweiten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) arbeitet man im Allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist jedoch wiederum möglich, jeweils auch unter erhöhtem Druck oder, sofern die zu isolierenden Produkte keine sehr niedrigen Siedepunkte aufweisen, unter vermindertem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung der zweiten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) setzt man auf 1 mol an einer Verbindung der Formel (X), (XII) der (XV) jeweils bis zu 10 mol an Kaliumhydroxid ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Dabei werden die Amine zweckmäßigerweise im Allgemeinen durch Hinzufügen von Säure, vorzugsweise wässriger Salzsäure, in Form ihrer Salze isoliert.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) können die Reaktionstemperaturen ebenfalls in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 10°C und 150°C, vorzugsweise bei Rückflusstemperatur.

Im Allgemeinen arbeitet man bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) setzt man auf 1 mol an Carbat der Formel (XVI) einem Überschuss, vorzugsweise bis zu 10 mol an wässriger Salzsäure ein. Die Aufarbeitung erfolgt wiederum nach üblichen Methoden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Triazolopyrimidine sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In dieser Formel haben R^2 , R^3 , R^4 und X vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die

bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

5 Bei den Triazolopyrimidinen der Formel (Ia) handelt es sich um erfindungsgemäße Stoffe. Sie lassen sich nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) herstellen.

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Sulfensäurehalogenide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel hat R^5 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits
10 im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden. .

Y^2 steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, besonders bevorzugt für Chlor.

15 Die Sulfensäurehalogenide der Formel (IV) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle üblichen, inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise
20 verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Dioxan, Tetrahydro-
25 furan, 1,2- Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid oder N-Methylpyrrolidon; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

- 36 -

Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle für derartige Umsetzungen üblichen Säurebindemittel in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO),
5 Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet
10 man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C.

Sowohl bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als auch des Verfahrens (b) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber
15 auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck, im allgemeinen zwischen 0,1 und 10 bar, zu arbeiten.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) setzt man auf 1 mol an Dihalogen-triazolo-pyrimidin der Formel (II) im allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise 0,8 bis 2 mol an Amin der Formel (III) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach
20 üblichen Methoden.

Zur Herstellung von Säureadditions-Salzen von Triazolopyrimidinen der Formel (I) kommen vorzugsweise diejenigen Säuren in Frage, die bereits im Zusammenhang
25 mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Säureadditions-Salze als bevorzugte Säuren genannt wurden.

Die Säureadditions-Salze der Verbindungen der Formel (I) können in einfacher Weise nach üblichen Salzbildungsmethoden, z.B. durch Lösen einer Verbindung der
30 Formel (I) in einem geeigneten inerten Lösungsmittel und Hinzufügen der Säure, z.B.

- 37 -

Chlorwasserstoffsäure, erhalten werden und in bekannter Weise, z.B. durch Abfiltrieren, isoliert und gegebenenfalls durch Waschen mit einem inerten organischen Lösungsmittel gereinigt werden.

- 5 Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

- 10 Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

- 15 Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

- 20 Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

- 25 Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;

Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;

- 30 Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder

- 38 -

Pseudoperonospora cubensis;

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;

5 *Bremia*-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;

Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;

Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;

10

Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;

Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;

15 *Venturia*-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);

20 *Cochliobolus*-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);

Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;

25 *Puccinia*-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;

Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;

Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;

30

- 39 -

Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;

Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;

5 Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;

Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;

10

Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;

Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;

15 Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;

Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise Pseudocercospora herpotrichoides.

20

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine sehr gute stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

25 Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

30

- 40 -

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum,
5 innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen
10 Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens. .

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

15 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

20 Mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen können Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können
25 Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaeren oder nicht schützbaeren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen
30 Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden wer-

den, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

5

Die Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

10

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

15

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

20

25

- 42 -

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,

Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,

Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,

Coniophora, wie *Coniophora puetana*,

Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,

Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,

Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,

Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,

Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,

Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,

Escherichia, wie *Escherichia coli*,

Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,

Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.

5 Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

10

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diato-meenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B.

15

20

25

30

- 44 -

- gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumergezeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.
- Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.
- Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.
- Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.
- Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

Fungizide:

- 5 Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,
- Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,
- 10 Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram, Carpropamid,
- 15 Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,
- 20 Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,
- Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenciclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon,
- 25 Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox, Fenhexamid,
- 30 Guazatin,

- 46 -

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

5 Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat,
Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan,
Isovaledione, Iprovalicarb,

10 Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfer-
naphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-
Mischung,

15 Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipirim, Mepronil, Metalaxyl,
Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax,
Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,

Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

20 Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin,
Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon,
Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin,
Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,

25 Quinconazol, Quintozen (PCNB), Quinoxifen,

Schwefel und Schwefel-Zubereitungen, Spiroxamine,

30 Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol,
Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl,

- 47 -

Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol,
Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,

Uniconazol,

5

Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

10

Dagger G,

OK-8705,

OK-8801,

15

α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -fluor-b-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -methoxy-a-methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-

20

triazol-1-ethanol,

(5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,

(E)-a-(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,

1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,

1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,

25

1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,

1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,

1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,

1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,

1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,

30

1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,

- 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,
 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,
 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
 5 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-β-D-glycopyranosyl)-α-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
 2-Aminobutan,
 10 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
 2-Phenylphenol(OPP),
 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
 15 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,
 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
 20 8-Hydroxychinolinsulfat,
 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-
 25 hydrochlorid,
 Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,
 Kaliumhydrogencarbonat,
 Methantetrathiol-Natriumsalz,
 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
 30 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,

- 49 -

- Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
 5 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
 N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropanocarboxamid,
 N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
 10 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,
 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
 O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,
 S-Methyl-1,2,3-benzothiadiaazol-7-carbothioat,
 15 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,
 4-[3,4-Dimethoxyphenyl)-3-(4-fluorphenyl)-acryloyl]-morpholin

Bakterizide:

- 20 Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin,
 Othilinin, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam,
 Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

- 25 Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb,
 Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin,
 Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

- 50 -

Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Bionpermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos,
5 Butocarboxim, Butylpyridaben,

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Resmethrin,
10 Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,

Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon,
15 Dichlorvos, Dicofol, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,

Eflusilanate, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopftora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,
20

Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazuron, Flubrocycythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,
25

Granuloseviren

Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,
30

- 51 -

Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,

Kernpolyederviren

5 Lambda-cyhalothrin, Lufenuron

Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae,
Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl,
Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazon, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin,
10 cin, Monocrotophos,

Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron

Omethoat, Oxamyl, Oxydemeton M
15

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phor-
rat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Piri-
miphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Prothoat,
Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimi-
20 difen, Pyriproxyfen,

Quinalphos,

Ribavirin
25

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,

Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron,
Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Theta-
30 cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam

- 52 -

hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

5 Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

YI 5302

Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

10

(1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanylidene)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat

(3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat

15

1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imin

2-(2-Chlor-6-fluorophenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol

2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion

2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

20

3-Methylphenyl-propylcarbamat

4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol

4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-3(2H)-pyridazinon

25

4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyridazinon

4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon
Bacillus thuringiensis strain EG-2348

Benzoesäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid

Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-
30 ester

- [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid
 Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd
 Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat
 N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin
 5 N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-
 1-carboxamid
 N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N"-nitro-guanidin
 N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid
 N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid
 10 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat
 N-Cyanomethyl-4-trifluormethyl-nicotinamid
 3,5-Dichlor-1-(3,3-dichlor-2-propenyloxy)-4-[3-(5-trifluormethylpyridin-2-yloxy)-
 propoxy]-benzol
- 15 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit
 Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.
- Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch
 sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimyko-
 20 tisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze,
 Schimmel und diphassische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans,
 Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie
 Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophy-
 ton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die
 25 Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren myko-
 tischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.
- Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus be-
 reiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritz-
 30 pulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die

- 54 -

Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Wie bereits oben erwähnt, können mit erfindungsgemäßen Wirkstoffen alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetic Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch konventio-

nelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

5 Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder
10 gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.
15

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen
20 Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer
25 Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte
30 herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kul-

- 56 -

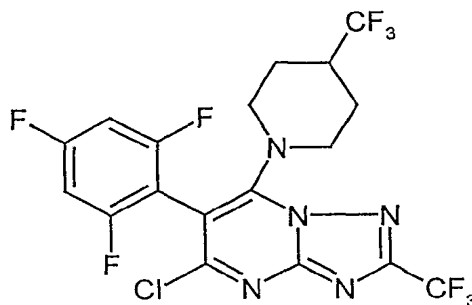
turpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende

- 57 -

Pflanzenarten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft mit den erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen.

Die Erfindung wird durch die folgenden Beispiele veranschaulicht.

Herstellungsbeispiele**Beispiel 1**

5

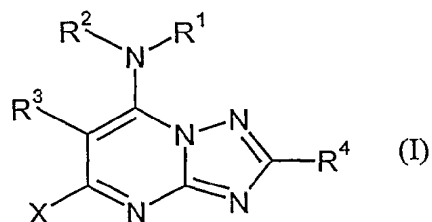
Verfahren (a)

10 In eine Lösung von 0,7 g (181 mMol) 5,7-Dichlor-2-(trifluormethyl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin und 0,28 g (1,81 mMol) 4-Trifluormethylpiperidin in 20 ml Dichlormethan werden 0,18 g Triethylamin gegeben. Das Gemisch wird 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Danach wird das Reaktionsgemisch mit soviel 1N Salzsäure versetzt und gerührt, dass der pH-Wert der Mischung bei 1 - 2 liegt (ca. 50 ml). Die organische Phase wird abgetrennt, über

15 Natriumsulfat getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt. Der Rückstand wird mit Petrolether verrührt und abgesaugt. Man erhält 0,3 g (30,3 % der Theorie) 5-Chlor-2-(trifluormethyl)-7-[4-(trifluormethyl)-1-piperidinyl]-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin.

20 HPLC: logP = 4,43

Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) erhalten.

Tabelle 1

Bsp. Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
1	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CF}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$		2,4,6- Trifluorophenyl	$-\text{CF}_3$	Cl		4,43	
2	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CF}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$		2,4,6- Trifluorophenyl	$-\text{C}_2\text{H}_5$	Cl		3,99	
3	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	$-\text{CF}_3$	Cl		3,94	
4	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	$-\text{C}_2\text{H}_5$	Cl		3,39	
5	$-\text{CH}_2-\text{CF}_3$	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	$-\text{C}_2\text{H}_5$	Cl		3,06	
6	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CF}_3$	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	$-\text{C}_2\text{H}_5$	Cl		3,18	
7	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CF}_3$	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	$-\text{CF}_3$	Cl		3,76	
8	$-\text{CH}_2-\text{CF}_3$	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	$-\text{CF}_3$	Cl		3,64	
9	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	t-Butyl	Cl		4,24	
10	$-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	$-\text{C}_2\text{H}_5$	2,4,6- Trifluorophenyl	$-\text{CF}_3$	Cl		4,73	
11	-i-Propyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	$-\text{CF}_3$	Cl		3,8	

- 60 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
12	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,01	
13	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,69	
14	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,83	
15	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		4,34	
16	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,76	
17	-i-Propyl	-H	2-Chlorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,39	
18	-CH ₂ -CN	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,02	
19	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlorophenyl	Cyclopropyl	Cl	AS	3,59	
20	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlorophenyl	Cyclopropyl	Cl	BS	3,61	
21	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,15	
22	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,82	
23	-CH ₂ -CN	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		2,27	
24	-CH ₂ -CN	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		2,91	
25	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Br		3,99	

- 61 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
26	-i-Propyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,71	
27	-NH ₂	-i-Propyl	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,77	
28	i-Propylamino	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,7	
29	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,93	
30	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,37	
31	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,04	
32	Cyclopentyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,25	
33	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,25	
34	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,22	
35	Cyclopropyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,53	
36	-CH ₃	-CH ₃	2-Chlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,13	
37	-C ₂ H ₅	-H	2-Chlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl			
38	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl			
39	-CH ₂ -CN	-H	2-Chlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl			

- 62 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
40	Cyclopentyl	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
41	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
42	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
43	2-Methoxyethyl	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
44	-CH ₃	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
45	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
46	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
47	Cyclohexyl	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
48	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
49	i-Propylamino	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,05	
50	1-Cyclopropylethylamino	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
51	n-Butylamino	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
52	-NH-CH ₂ -CF ₂ -CHF ₂	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
53	-NH-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			

- 63 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
54	Allylamino	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
55	-NH-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
56	i-Propylamino	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
57	t-Butylamino	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl			
58	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3	
59	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,86	
60	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,43	
61	n-Propyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,75	
62	Cyclopentyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,23	
63	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,23	
64	2-Methoxyethyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,34	
65	Cyclopropyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,51	
66	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,09	
67	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,6	

- 64 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
68	Cyclopropylmethyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,86	
69	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,04	
70	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,85	
71	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,57	
72	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,29	
73	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,94	
74	n-Propyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,14	
75	Cyclopentyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,66	
76	-i-Propyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,15	
77	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,71	
78	2-Methoxyethyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		2,68	
79	Cyclopropyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		2,85	
80	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,53	
81	Cyclopropylmethyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,23	

- 65 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
82	-i-Propyl	-H	3-Chlor-4-fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,01	
83	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,2	
84	i-Propylamino	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,68	
85	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,57	
86	-CH ₃	-CH ₃	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,49	
87	-C ₂ H ₅	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,44	
88	-C(CH ₃) ₂ -CF ₃	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,7	
89	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,43	
90	-CH ₃	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,12	
91	-C ₂ H ₅	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		2,78	
92	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		2,8	
93	-CH ₃	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		2,44	
94	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		4,27	
95	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,69	123-25

- 66 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
96	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,73	100-02
97	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	3-Chlor-4-fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,32	
98	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,85	
99	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,15	
100	-CH ₃	-CH ₃	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,6	
101	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,18	
102	-C ₂ H ₅	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,5	
103	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,92	
104	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,46	
105	-C(CH ₃) ₂ -CF ₃	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,37	
106	n-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,82	
107	2-Methoxyethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,38	
108	-CH ₃	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,17	
109	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,76	

- 67 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
110	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,09	
111	Cyclopropylmethyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,89	
112	-CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,84	
113	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,03	
114	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6- Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,91	
115	-CH(CH ₂ OH)-COOCH ₃	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,93	
116	-CH(CH ₃)-CH ₂ -O-CH ₃	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,64	
117	-CH(CH ₃)-CH=CH-CH(CH ₃)-		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,52	
118	AB3	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,11	
119	AB4		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,65	
120	AB5	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,47	
121	AB6		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,13	
122	-CH(CH ₃)-CH ₂ -OH	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,93	
123	-CH(CH ₃)-CH(O-CH ₃) ₂	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,74	

- 68 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
124	-CH(CH ₃)-COOCH ₃	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,45	
125	-CH ₂ -COOCH ₃	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,13	
126	-CH(CH ₃)-COO-t-butyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,44	
127	-NH ₂	i-Butyl	2,4,6- Trifluorophenyl	-C ₂ H ₅	Cl		3,47	176-78
128	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,84	
129	-NH ₂	i-Butyl	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,06	Paste
130	-NH ₂	i-Butyl	2-Chlor-6- Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,12	157-8
131	-NH ₂	i-Butyl	3-Chlor-4- fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,31	155-8
132	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-6- Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,01	
133	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,9	
134	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,37	
135	i-Butoxy	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,88	
136	-O-C ₂ H ₅	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,22	
137	3-Chlorbenzyloxy	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,21	

- 69 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
138	4-Chlorbenzyloxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,23	
139	-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,78	
140	Allyloxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,38	
141	t-Butoxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,68	
142	2-Hexahydropyranyloxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,54	
143	-O-CH ₃	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,54	
144	O-i-Propyl	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,46	
145	i-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,14	
146	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,5	
147	2-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,1	
148	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-CH ₃	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,5	
149	Propargyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,77	
150	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,8	
151	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,67	

- 70 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
152	Allyl	-CH ₃	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,18	
153	(2-Furyl)methyl	-CH ₃	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,22	
154	i-Butyl	-CH ₃	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,63	
155	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,55	
156	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,59	
157	Allyl	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,5	
158	(2-Furyl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,55	
159	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,26	
160	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,14	
161	n-Butyl	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		4,08	
162	Cyclopropylmethyl	n-Propyl	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		4,08	
163	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,68	
164	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,81	
165	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,9	

- 71 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
166	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,9	
167	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,03	
168	AB7		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,73	
169	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,84	
170	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,61	
171	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,17	
172	n-Propyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,52	
173	Cyclopentyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,97	
174	-i-Propyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,52	
175	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,98	
176	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,2	
177	2-Methoxyethyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,12	
178	Cyclopropyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,28	
179	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,84	

- 72 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
180	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,36	
181	Cyclopropylmethyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,62	
182	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,78	
183	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,56	
184	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,63	
185	1-Cyclohexylethyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		4	
186	Cyclohexyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,28	
187	2-Butyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,82	
188	3-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,37	
189	3,5-bis-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,62	
190	4-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,39	
191	i-Butyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3	
192	n-Butyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,04	
193	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,4	

- 73 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
194	2-Butyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,01	
195	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,76	
196	-i-Propyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,69	
197	Cyclohexyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,46	
198	1-Cyclohexylethyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		4,24	
199	Cyclopropyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,45	
200	Cyclopropylmethyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,77	
201	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,72	
202	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,56	
203	Allyl	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,06	
204	(2-Furyl)methyl	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,1	
205	i-Butyl	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,49	
206	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,41	
207	Allyl	-C ₂ H ₅	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,35	

- 74 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
208	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,18	
209	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,26	
210	i-Butyl	-H	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,1	
211	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,57	
212	2-Butyl	-H	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,09	
213	Cyclopentyl	-H	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,28	
214	-i-Propyl	-H	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		2,75	
215	Cyclopropyl	-H	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		2,54	
216	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		2,85	
217	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		2,83	
218	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,84	
219	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		2,62	
220	Allyl	-CH ₃	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,19	
221	i-Butyl	-CH ₃	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,65	
222	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		2,64	
223	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,57	
224	Allyl	-C ₂ H ₅	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,5	
225	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		2,94	
226	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,27	
227	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		0,75	
228	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		0,75	
229	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,92	

- 75 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
230	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,94	
231	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,7	
232	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,63	
233	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,48	
234	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		2,38	
235	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,09	
236	2-Methoxyethyl	-H	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		2,3	
237	Propargyl	-CH ₃	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		2,75	
238	(2-Furyl)methyl	-CH ₃	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,2	
239	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,23	
240	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,11	
241	n-Butyl	-C ₂ H ₅	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		4,1	
242	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,24	
243	Cyclopropylmethyl	n-Propyl	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		4,07	
244	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,7	
245	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		0,75	
246	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,48	
247	n-Butyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		4,18	
248	i-Butyl	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,14	
249	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,59	

- 76 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
250	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,8	
251	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,95	
252	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,33	
253	-CH ₂ -CN	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,11	
254	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,55	
255	Cyclopentyl	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,29	
256	-i-Propyl	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,77	
257	2-Methoxyethyl	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,42	
258	Cyclopropyl	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,77	
259	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,18	
260	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,77	
261	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,72	
262	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,99	
263	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,95	

- 77 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
264	2-Butyl	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,14	
265	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -		2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,33	
266	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,07	
267	Allyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,59	
268	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,29	
269	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,03	
270	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,14	
271	Propargyl	-CH ₃	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,77	
272	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,48	
273	Allyl	-CH ₃	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,26	
274	(2-Furyl)methyl	-CH ₃	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,26	
275	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,63	
276	i-Butyl	-CH ₃	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,68	
277	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,72	

- 78 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
278	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,02	
279	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2-Chlor-6- Fluorphenyl	-CH ₃	Cl			
280	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,4- Difluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,14	
281	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,74	
282	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorphenyl	-CH ₃	Cl		1,9	
283	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -		2,4- Difluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,11	
284	AB10		2,4- Difluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,68	
285	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,4- Difluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,7	
286	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4- Difluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,74	
287	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,75	
288	-CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorphenyl	-CH ₃	Cl		4,01	
289	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,5	
290	-CH ₂ -CH=C(C ₂ H ₅)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,94	
291	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -		2,4- Difluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,49	

- 79 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
292	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,78	
293	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,49	
294	-CH ₂ -CH ₂ -CH(NH-COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,85	
295	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,32	
296	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,3	
297	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,97	
298	4-Tolyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,05	
299	4-Fluorophenyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,7	
300	AB13		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,28	
301	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,7	
302	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -		2-Chlor-6- Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,99	
303	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,73	
304	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,02	
305	AB8		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,64	

- 80 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
306	AB9		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,18	
307	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,83	
308	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,01	
309	AB10		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,6	
310	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		4,08	
311	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,57	
312	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,63	
313	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,64	
314	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,03	
315	-CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,91	
316	-CH ₂ -CH=C(C ₂ H ₅)-CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,84	
317	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,39	
318	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,69	
319	-CH ₂ -CH ₂ -CHBr-CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,33	

- 81 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
320	-CH(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,04	
321	AB12		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,15	
322	AB11		2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,26	
323	-CH ₂ -CH ₂ -CH(NH-COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,78	
324	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,12	
325	AB14		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,56	
326	3-Tolyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,89	
327	AB13		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,22	
328	i-Butyl	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,85	
329	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,27	
330	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,55	
331	Propargyl	-CH ₃	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,54	
332	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,43	
333	Allyl	-CH ₃	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,95	

- 82 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
334	-CH ₂ -CH(OCH ₃) ₂	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,55	
335	i-Butyl	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,37	
336	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,45	
337	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,3	
338	n-Butyl	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,46	
339	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,65	
340	(2-Furyl)methyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,28	
341	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3	
342	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,74	
343	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,85	
344	n-Butyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,82	
345	Cyclopropylmethyl	n-Propyl	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,83	
346	(2-Tetrahydropyranyl)methyl	n-Propyl	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,95	
347	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,39	

- 83 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
348	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,12	
349	3-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,52	
350	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,23	
351	Propargyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,67	
352	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,58	
353	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,37	
354	(2-Furyl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,39	
355	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,04	
356	Cyclopropylmethyl	n-Propyl	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,91	
357	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,6	
358	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,89	
359	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl	AS	2,95	
360	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl	BS	2,96	
361	i-Butoxy	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,98	

- 84 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
362	-O-C ₂ H ₅	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,28	
363	Benzyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,93	
364	3,5-Dichlorbenzyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,76	
365	4-Trifluormethylbenzyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,43	
366	2-Chlorbenzyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,21	
367	3-Chlorbenzyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,28	
368	4-Chlorbenzyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,3	
369	4-Fluorbenzyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,98	
370	-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,87	
371	3-Trifluormethylbenzyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,38	
372	-n-Butoxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,98	
373	Allyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,42	
374	t-Butoxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,75	
375	2-Hexahydropyranyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,59	
376	-O-CH ₃	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,03	
377	-O-CH ₃	-CH ₃	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,5	
378	O-i-Propyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,54	
379	1-Cyclopropylethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,09	
380	-CH ₂ -CF ₃	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,42	
381	-CH ₃	-CH ₃	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,34	
382	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -		2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,8	
383	-C ₂ H ₅	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,3	

- 85 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
384	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,19	
385	Cyclopentyl	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,11	
386	-i-Propyl	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,63	
387	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,95	
388	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,16	
389	-CH ₃	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,02	
390	Cyclopropyl	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,41	
391	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,53	
392	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,37	
393	Cyclopropylmethyl	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,72	
394	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,68	
395	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,7	
396	1-Cyclohexylethyl	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		4,16	
397	Cyclohexyl	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,43	
398	2-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,49	
399	3,5-bis-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,73	
400	4-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,48	
401	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,91	
402	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,05	
403	-CH ₂ -CN	-H	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		2,03	
404	(2-Furyl)methyl	-C ₂ H ₅	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,56	
405	Cyclopentyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,24	

- 86 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
406	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,68	
407	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -COCH ₃	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,53	
408	2-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,56	
409	4-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,56	
410	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,8	
411	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,34	
412	-CH ₂ -CN	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,34	
413	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-C ₂ H ₅	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,58	
414	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	Cyclopropyl	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,29	
415	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,95	
416	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,36	
417	-CH(CH ₃)-CH=CH ₂	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,85	
418	-CH ₃	-CH ₃	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,37	
419	-C ₂ H ₅	-H	2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,31	

- 87 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
420	-CH ₂ -CN	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,91	
421	-C(CH ₃) ₂ -CF ₃	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,34	
422	-CH ₃	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,03	
423	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,33	
424	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,56	
425	2-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,52	
426	-OH	-i-Propyl	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,52	
427	Benzyloxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,93	
428	3,5-Dichlorbenzyloxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,75	
429	2,4-Dichlorbenzyloxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,69	
430	4-Trifluormethylbenzyloxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,44	
431	2-Chlorbenzyloxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,13	
432	4-Fluorbenzyloxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,9	
433	3-Trifluormethylbenzyloxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,41	

- 88 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
434	-n-Butoxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,96	
435	2,6-Dichlorbenzyloxy	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,31	
436	-O-CH ₃	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,07	
437	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	Cl		3,1	
438	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	F		2,97	
439	2-Fluorocyclopropyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,3	
440	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	Cyclopropyl	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3	
441	-CH ₂ -CH(NH ₂)-CH ₂ -CH ₂ -		2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,19	
442	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,49	
443	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -		2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,85	
444	4-Tolyl	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,01	
445	4-Fluorophenyl	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,71	
446	AB28		2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,34	
447	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,59	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
448	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,49	
449	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6- Fluorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,61	
450	AB8		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,73	
451	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		4,16	
452	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,2	
453	-CH(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,36	
454	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,96	
455	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,94	
456	3-Tolyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3	
457	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-6- Fluorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,59	
458	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,58	
459	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6- Fluorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,46	
460	i-Butyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,69	
461	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,19	

- 90 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
462	2-Butyl	-H	2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,69	
463	Cyclopentyl	-H	2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,9	
464	-i-Propyl	-H	2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,35	
465	Cyclopropylmethyl	-H	2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,43	
466	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,34	
467	i-Butyl	-CH ₃	2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,36	
468	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,29	
469	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,27	
470	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,64	
471	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,9	
472	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,52	
473	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,66	
474	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,22	
475	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,02	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
476	i-Butyl	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,64	
477	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,08	
478	2-Butyl	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,66	
479	Cyclopentyl	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,83	
480	-i-Propyl	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,33	
481	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,19	
482	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,4	
483	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Chlor-6- Fluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,31	
484	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,71	
485	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,74	
486	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6- Fluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,74	
487	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,42	
488	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,39	
489	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4- Difluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl	AS	3,51	

- 92 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
490	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl	BS	3,52	
491	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,37	96-98
492	i-Butyl	-H	2-Chlorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,76	
493	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,27	
494	2-Butyl	-H	2-Chlorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,76	
495	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Chlorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,41	
496	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2-Chlorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,32	
497	i-Butyl	-CH ₃	2-Chlorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,41	
498	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2-Chlorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,99	
499	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2-Chlorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,61	
500	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,22	
501	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,41	
502	(2,2-Dichlorcyclopropyl)methyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	Cl		3,68	
503	-i-Propyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,5	

- 93 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
504	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,58	
505	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl	AS + BS	3,75	
506	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,35	
507	(2,2-Dichlorocyclopropyl)methyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,18	133-36
508	(2,2-Dichlorocyclopropyl)methyl	-CH ₃	2-Chlorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,29	
509	(2,2-Dichlorocyclopropyl)methyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,26	
510	(2,2-Dichlorocyclopropyl)methyl	-CH ₃	2-Chlor-6-Fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,37	
511	-CH ₂ -CH=C(C ₂ H ₅)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,59	
512	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,14	
513	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,45	
514	AB12		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,78	
515	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,07	
516	-CH ₂ -CH ₂ -CH(NH-COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,2	
517	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,03	

- 94 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
518	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,85	
519	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,58	
520	AB14		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,25	
521	4-Tolyl	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,6	
522	AB13		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,87	
523	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,38	
524	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,84	
525	i-Butyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,03	
526	n-Butyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,07	
527	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,4	
528	2-Butyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,03	
529	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,7	
530	Cyclopentyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,21	
531	Cyclopropyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,49	

- 95 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
532	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,58	
533	Cyclopropylmethyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,8	
534	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,75	
535	t-Butyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,19	
536	3-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,44	
537	4-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,43	
538	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		1,77	
539	Propargyl	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,65	
540	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,62	
541	Allyl	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,09	
542	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,19	
543	(2-Furyl)methyl	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,11	
544	i-Butyl	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,54	
545	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,73	

- 96 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
546	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,44	
547	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		1,91	
548	Allyl	-C ₂ H ₅	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,4	
549	(2-Furyl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,42	
550	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-C ₂ H ₅	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,46	
551	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,05	
552	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,77	
553	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,39	
554	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	Cyclopropyl	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,28	
555	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		2,76	
556	Cyclohexyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,47	
557	1-Cyclohexylethyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		5,12	
558	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4- Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,03	
559	AB30	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,71	

- 97 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
560	n-Butyl	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,89	
561	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,28	
562	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,62	
563	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,17	
564	-CH ₂ -CN	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,18	
565	-CH ₂ -COOCH ₃	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,32	
566	(2-Furyl)methyl	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,97	
567	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,46	
568	Allyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,3	
569	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,41	
570	2-Thienylmethyl	n-Propyl	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,96	
571	-CH ₂ -CH ₂ -NH ₂	-i-Propyl	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		1,28	
572	AB31		2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,66	
573	AB31		2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,9	

- 98 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
574	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,07	
575	AB31		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,74	
576	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,95	
577	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl			
578	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -O-		2,6- Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,61	
579	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,14	
580	-CH(CH ₃)-CH=CH-CH(CH ₃)-		2-Chlorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,19	
581	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4,6- Trifluorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,03	
582	-CH(CH ₃)-CH=CH-CH(CH ₃)-		2,4,6- Trifluorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,17	
583	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-6- Fluorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,12	
584	-CH(CH ₃)-CH=CH-CH(CH ₃)-		2-Chlor-6- Fluorophenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,15	
585	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -O-		2,4,6- Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,93	
586	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4- fluorophenyl	Cyclo- propyl	Cl	AS + BR	4,25	

- 99 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
587	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl	AR + BS	4,25	
588	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,6	
589	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-4-fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,23	
590	AB31		2-Chlor-4-fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,99	
591	Allyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,96	
592	(2-Furyl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,97	
593	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,78	
594	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,46	
595	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,54	
596	n-Butyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,52	
597	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,73	
598	Cyclopropylmethyl	n-Propyl	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,53	
599	(2-Tetrahydropyranyl)methyl	n-Propyl	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,71	

- 100 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
600	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,22	
601	2-Thienylmethyl	n-Propyl	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,64	
602	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,84	
603	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		2,2	
604	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,76	
605	AB9		2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		1,46	
606	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,36	
607	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		2,29	
608	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,72	
609	AB10		2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,22	
610	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,72	
611	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,3	
612	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,37	
613	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,41	

- 101 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
614	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,57	
615	-CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,67	
616	2-Methoxyethyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,07	
617	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,72	
618	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,82	
619	Dimethylamino	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,29	
620	1-Cyclopropylethylamino	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,81	
621	i-Butyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,9	
622	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,37	
623	2-Butyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,9	
624	Cyclopentyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,13	
625	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,63	
626	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,59	
627	i-Butyl	-CH ₃	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,51	

- 102 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
628	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		3,46	
629	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,41	
630	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,77	
631	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		3,81	
632	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,13	
633	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,08	
634	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		3,72	
635	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,37	
636	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		3,18	
637	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,61	
638	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		3,37	
639	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-4-fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,23	
640	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-CH ₃	Cl	AS + BS	3,19	

- 103 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
641	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-CH ₃	Cl	AS	3,2	
642	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-CH ₃	Cl	BS	3,17	
643	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlor-4-fluorphenyl	-CH ₃	Cl		4,06	
644	i-Butyl	-H	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,38	
645	n-Butyl	-H	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,6	
646	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4	
647	2-Butyl	-H	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,57	
648	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,25	
649	n-Propyl	-H	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,2	
650	Cyclopentyl	-H	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,76	
651	-i-Propyl	-H	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		3,2	
652	Cyclohexyl	-H	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,02	
653	1-Cyclohexylethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		4,84	
654	2-Methoxyethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	Cyclopropyl	Cl		2,75	

- 104 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
655	Cyclopropyl	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,95	
656	Cyclopropylmethyl	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,26	
657	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,22	
658	3-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,98	
659	4-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,93	
660	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,24	
661	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		1,56	
662	Propargyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,21	
663	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,1	
664	Allyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,61	
665	3-(Dimethylamino)-propyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		1,61	
666	-CH ₂ -CH(OCH ₃) ₂	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,24	
667	(2-Furyl)methyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,63	
668	i-Butyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,07	

- 105 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
669	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,16	
670	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,05	
671	n-Butyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,21	
672	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,25	
673	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,08	
674	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,4,6-Trifluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,6	
675	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,68	
676	i-Butyl	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,08	
677	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,98	
678	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,68	
679	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,25	
680	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,17	
681	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,34	

- 106 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
682	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,9	
683	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,78	
684	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,18	
685	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,56	
686	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,42	
687	-C ₂ H ₅	-H	2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,08	
688	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,43	
689	AB31		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,32	
690	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,56	
691	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-4-fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,94	
692	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,83	
693	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		3,3	
694	-CH ₂ -CHF ₂	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,41	
695	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -O-		2,4-Difluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,79	

- 107 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
696	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,46	
697	-CH ₂ -CHF ₂	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-CH ₃	Cl		2,54	
698	i-Butyl	-CH ₃	2-Chlor-6-Fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,32	
699	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2-Chlor-6-Fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		3,3	
700	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2-Chlor-6-Fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,21	
701	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-Fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		3,66	
702	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2-Chlor-6-Fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		3,94	
703	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6-Fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,1	
704	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6-Fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		3,55	
705	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2-Chlor-6-Fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,54	
706	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6-Fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,59	
707	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6-Fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		3,63	
708	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6-Fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		4,19	
709	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6-Fluorphenyl	Cyclo-propyl	Cl		3,05	

- 108 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
710	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4-Dichlorophenyl	Cyclopropyl	Cl	AS	4,12	
711	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4-Dichlorophenyl	Cyclopropyl	Cl	BS	4,19	
712	-C ₂ H ₅	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,97	
713	-CH ₂ -CN	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,42	
714	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,17	
715	2-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,08	
716	3,5-bis-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,31	
717	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,28	
718	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,79	
719	-CH ₂ -CN	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,79	
720	-CH ₂ -COOCH ₃	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,95	
721	-CH ₂ -CH ₂ -Cl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,5	
722	-CH ₃	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,06	
723	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		1,65	
724	-CH ₂ -CH ₂ -NH ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		1,47	
725	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,07	
726	3-Aminopropyl	n-Propyl	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		1,61	

- 109 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
727	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	Cyclopropyl	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,84	
728	AB8		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,17	
729	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,14	
730	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,07	
731	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,38	
732	-CH ₂ -CH ₂ -CHBr-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,08	
733	-CH(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,92	
734	AB11		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		1,55	
735	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		1,43	
736	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,63	
737	3-Tolyl	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,61	
738	4-Fluorophenyl	-H	2,4-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,27	
739	-i-Propyl	-H	2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,14	
740	Cyclopentyl	-H	2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,66	
741	-CH ₂ -CHF ₂	-H	2,4-Dichlorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,42	
742	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4-Dichlorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,72	
743	AB31		2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,23	
744	i-Butyl	-H	2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,44	

- 110 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
745	(2,2-Dichlorocyclopropyl)methyl	-H	2-Chlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,78	
746	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4- fluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl	AS + BS + AR + BR		
747	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4- fluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl	AS + BR	3,73	
748	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4- fluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl	AR + BS	3,77	
749	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4- Dichlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,72	
750	-NH ₂	i-Butyl	2,4- Dichlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,36	
751	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,6- Difluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,82	
752	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,6- Difluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,31	
753	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,6- Difluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,47	
754	-NH ₂	i-Butyl	2,6- Difluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,47	
755	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4- Dichlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		4,02	208-9
756	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4- Dichlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl	AR	4,72	
757	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4- Dichlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl	BR	4,72	
758	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4- Dichlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl	AS	4,72	
759	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4- Dichlorphenyl	Cyclo- propyl	Cl	BS	4,72	
760	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,6- Difluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,28	
761	2-Butyl	-H	2,6- Difluorphenyl	Cyclo- propyl	Cl		3,44	

- 111 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
762	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,9	
763	-CH ₂ -CHF ₂	-H	2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,72	
764	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,98	
765	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -O-		2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,26	
766	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	-CH ₃	Cl		2,8	
767	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl	AS	3,73	
768	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl	BS	3,77	
769	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Dichlorophenyl	Cyclopropyl	Cl		5,25	
770	AB32		2,6-Difluorophenyl	Cyclo-l	Cl		3,32	
771	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,04	
772	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,19	
773	-NH ₂	i-Butyl	2,4,6-Trifluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,65	186-8
774	AB33	-H	2,4-Dichlorophenyl	Cyclopropyl	Cl		2,7	
775	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl	AR + BR	4,23	
776	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl	BR	4,25	
777	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl	AR	4,23	
778	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl	AS	4,23	

- 112 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
779	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl	BS	4,23	
780	AB31		2,4-Dichlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,41	
781	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4-Dichlorophenyl	-CH ₃	Cl	AS	3,55	210-1
782	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4-Dichlorophenyl	-CH ₃	Cl	BS	3,58	216-7
783	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Dichlorophenyl	-CH ₃	Cl		4,56	
784	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Dichlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,35	
785	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-4-fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,87	
786	AB32		2,4,6-Trifluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,56	
787	1-Methylethylidenamino	i-Butyl	2,6-Difluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,21	
788	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4-Dichlorophenyl	-CH ₃	Cl		4,06	132-35
789	i-Butyl	-H	2,4-Dichlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,68	
790	i-Butyl	-H	2,4-Dichlorophenyl	Cyclopropyl	Cl		4,3	
791	-NH ₂	i-Butyl	2-Chlor-6-Fluorophenyl	Cyclopropyl	Cl		3,74	175-6
792	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,27	
793	AB8		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		2,56	
794	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,44	
795	AB9		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		1,67	

- 113 -

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
796	AB10		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,8	
797	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		5,18	
798	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,8	
799	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,07	
800	-CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		5,03	
801	-CH ₂ -CH=C(C ₂ H ₅)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,95	
802	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,55	
803	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,81	
804	-CH(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,32	
805	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,43	
806	-CH ₂ -CH ₂ -CH(NH-COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		2,71	
807	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		1,65	
808	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,1	
809	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,45	
810	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,04	
811	2-Tolyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,99	
812	3-Tolyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,04	
813	4-Tolyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,08	

- 114 -

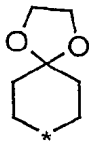
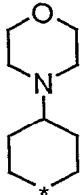
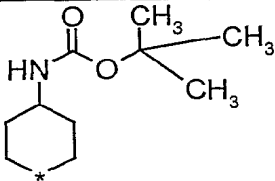
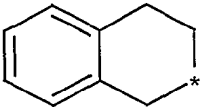
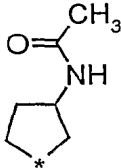
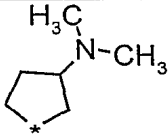
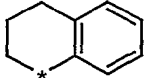
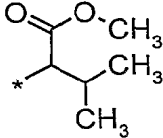
Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Iso- mer	logP	Fp.: (°C)
814	4-Fluorophenyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		3,69	
815	AB13		2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,35	
816	-NH ₂	i-Butyl	2,4-Dichlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,71	
817	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Dichlorophenyl	-CH ₃	Cl		3,67	
818	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2,4-Difluorophenyl	-CF ₃	Cl		4,73	

Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure)

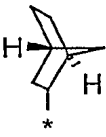
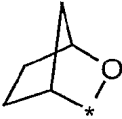

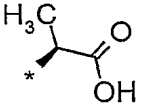
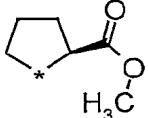
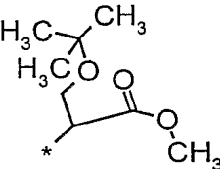
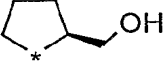
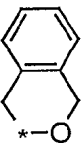
5 *) bedeutet, dass R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring bilden.

10 **) Die Produkte wurden teilweise als Stereoisomere isoliert. "S", bzw. "R" bedeutet S- bzw. R-Konfiguration am Chiralitätszentrum; "AS" bedeutet eine eindeutige aber unbekannte Konfiguration am Atropiezentrum und S-Konfiguration am Chiralitätszentrum. BS bedeutet die jeweils andere eindeutige aber unbekannte Konfiguration am Atropiezentrum und S-Konfiguration am Chiralitätszentrum. "AR" und "BR" bedeuten wiederum die jeweiligen komplementären Konfigurationen am Atropiezentrum gepaart mit der R-Konfiguration am Chiralitätszentrum. Demnach sind bei
15 gleichen Substituenten "AR" und "BS", sowie "AS" und "BR" jeweils Enantiomerenpaare.

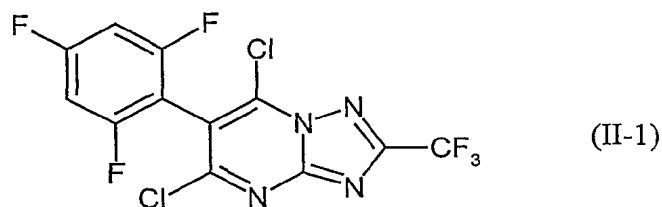
- 115 -

AB10	
AB11	
AB12	
AB14	
AB8	
AB9	
AB28	
AB3	

- 116 -

AB30	
AB31	
AB32	
AB33	
AB4	
AB5	
AB6	
AB7	

* markiert jeweils die Bindungsstelle

Herstellung von AusgangsstoffenBeispiel 819

5

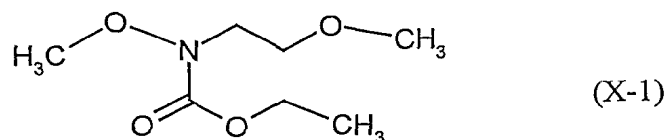
2,6 g (7,43 mMol) 2-Trifluormethyl-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]-
 pyrimidin-5,7-diol werden bei Raumtemperatur in 20 ml Phosphoroxychlorid gelöst,
 portionsweise mit 1,2 g Phosphorpentachlorid versetzt und anschließend 6 Stunden
 10 unter Rückfluss erhitzt. Flüchtige Bestandteile der Reaktionsmischung werden unter
 vermindertem Druck abdestilliert. Der Rückstand wird mit 20 ml Wasser versetzt
 und mit 20 ml Dichlormethan extrahiert. Die organische Phase wird über Natrium-
 sulfat getrocknet und an Kieselgel mit Dichlormethan chromatografiert. Man erhält
 1,2 g (37,6 % der Theorie) 5,7-Dichlor-2-(trifluormethyl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-
 15 [1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin.

HPLC: logP = 3,71

Beispiel 820

20

Verfahren (e), erste Stufe:

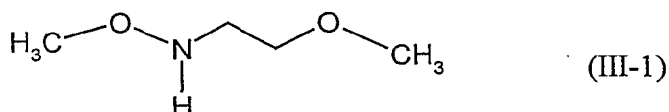


- 118 -

1 000 mg N-Methoxy-carbaminsäureethylester werden in 10,0 ml Dimethylformamid vorgelegt und portionsweise mit 403 mg Natriumhydrid versetzt, wobei die Temperatur durch Kühlung auf 30°C eingestellt wurde. Die Reaktionsmischung wird für 2 Stunden bei 30°C gerührt und anschließend mit 3 500 mg 2-Bromethyl-methylether versetzt. Die Reaktionsmischung wird für 18 Stunden bei 20°C bis 25°C gerührt und anschließend in 20 ml Wasser eingerührt. Die erhaltene Reaktionsmischung wird unter vermindertem Druck zur Trockne eingeengt und viermal mit je 30 ml Dichlormethan extrahiert. Die organischen Extrakte werden über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und unter vermindertem Druck zur Trockne eingeengt.

Man erhält 1 200 mg (N-Methoxy-N-methoxyethyl)carbaminsäure-ethylester (Reinheit 77,6 %, Ausbeute 62,6 %).

Verfahren (e), zweite Stufe:



200 mg (N-Methoxy-N-methoxyethyl)-carbaminsäureethylester werden in 4,0 ml wässrigem Ethanol (59 %ig) vorgelegt, mit 240,6 mg Kaliumhydroxid versetzt und für 18 Stunden bei 40°C gerührt. Die Reaktionsmischung wird dann in 50 ml Wasser eingerührt, dreimal mit je 20 ml Diethylether und dreimal mit je 20 ml Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit je 20 ml Wasser gewaschen, getrocknet und bei 20°C unter vermindertem Druck auf ein Volumen von 20 ml eingeengt.

Die erhaltene Lösung wird unter Eiskühlung mit 2 ml Salzsäure versetzt, 1 Stunde bei Raumtemperatur gerührt und bei 20°C unter vermindertem Druck zur Trockne eingeengt.

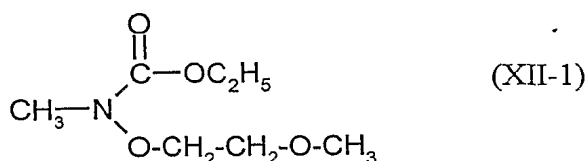
- 119 -

Das erhaltene Produkt wird dreimal mit je 15 ml Methanol digeriert und anschließend bei 20°C unter vermindertem Druck zur Trockne eingeengt.

Man erhält 140 mg N-Methoxy-N-methoxyethylamin-hydrochlorid (Ausbeute 87,6 %).

Beispiel 821

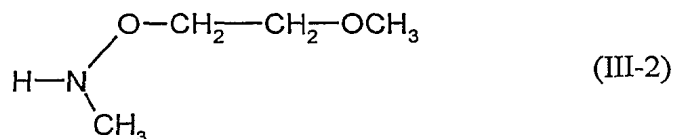
Verfahren (f), erste Stufe:



Ein Gemisch aus 1000 mg N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester, 1166 mg 2-Bromethyl-methylether und Rühren auf Rückflusstemperatur erhitzt und dann tropfenweise mit einer Lösung von 493 mg Kaliumhydroxid in 5 ml Ethanol versetzt. Man kocht das Reaktionsgemisch 10 Stunden unter Rückfluss und arbeitet dann auf, indem man das Reaktionsgemisch filtriert und das Filtrat unter vermindertem Druck einengt. Der verbleibende Rückstand wird mit einem Gemisch aus Wasser und Essigsäureethylester versetzt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit gesättigter, wässriger Ammoniumchlorid-Lösung und dann mit Wasser gewaschen. Anschließend wird die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet und unter vermindertem Druck eingeengt. Man erhält auf diese Weise 0,7 g eines Produktes, das gemäß Gaschromatogramm zu 83 % aus (N-Methyl-N-methoxyethoxy)-carbaminsäure-ethylester besteht. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 39 % der Theorie.

Verfahren (f), zweite Stufe:

- 120 -

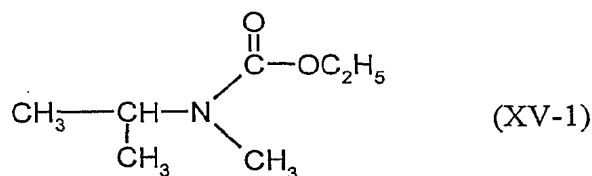


Ein Gemisch aus 200 mg (N-Methyl-N-methoxyethoxy)-carbaminsäure-ethylester, 4 ml Ethanol und 4 ml Wasser wird mit 240,6 mg pulverisiertem Kaliumhydroxid
 5 versetzt und 2 Stunden bei 40°C gerührt. Das Reaktionsgemisch wird danach in 50 ml Wasser eingerührt, dann dreimal mit je 20 ml Diethylether und anschließend dreimal mit je 20 ml Methylenchlorid extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit je 20 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bei Raumtemperatur unter vermindertem Druck auf ein Volumen von 20 ml einge-
 10engt. Die erhaltene Lösung wird unter Eiskühlung mit 1 ml etherischer Salzsäure versetzt. Die sich abscheidenden Kristalle werden abfiltriert und getrocknet. Man erhält auf diese Weise 190 mg an N-Methyl-N-methoxyethoxy-amin-hydrochlorid.

Beispiel 822

15

Verfahren (g), erste Stufe:



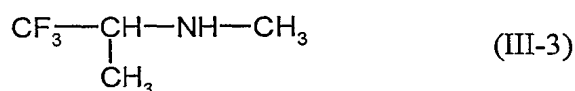
20 Ein Gemisch aus 2000 mg N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-carbaminsäure-ethyl-ester und 20 ml Tetrahydrofuran wird bei Raumtemperatur unter Rühren mit 475 mg Natriumhydrid versetzt. Danach wird unter Rühren bei Raumtemperatur eine Lösung von 4600 mg Iodmethan in 10 ml Tetrahydrofuran hinzuge tropft. Das Reaktions-
 25gemisch wird 16 Stunden bei 50°C gerührt und dann mit Wasser versetzt. Man extrahiert dreimal mit je 20 ml Methylenchlorid, trocknet die vereinigten organischen

- 121 -

Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck ein. Man erhält 1000 mg eines Produktes, das gemäß Gaschromatogramm zu 75 % aus N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-N-methyl-carbaminsäure-ethylester besteht. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 34,86 %.

5

Verfahren (g), zweite Stufe:

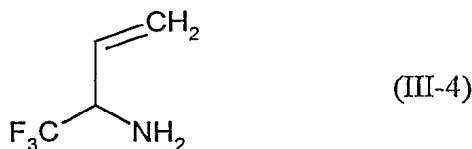


- 10 Ein Gemisch aus 1000 mg N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-N-methyl-carbaminsäure-ethylester, 20 ml Ethanol und 20 ml Wasser wird mit 1070 mg pulverisiertem Kaliumhydroxid versetzt und 66 Stunden bei 40°C gerührt. Danach wird das Reaktionsgemisch mit Wasser verdünnt und dreimal mit je 20 ml eines Gemisches
- 15 vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet und dann bei Raumtemperatur unter leicht vermindertem Druck eingeeengt. Die erhaltene Lösung wird unter Eiskühlung mit etherischer Salzsäure versetzt und 60 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Nach dem Einengen unter vermindertem Druck erhält man
- 20 280 mg an N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-N-methylamin-hydrochlorid. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 34 % der Theorie.

Beispiel 823

Verfahren (h):

25



- 122 -

600 mg N(1-Trifluormethyl-2-propen)-carbaminsäurebenzylester werden in 8,0 ml 16 %iger Salzsäure für 1,5 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Nach dem Abkühlen auf 20°C wird zweimal mit je 20 ml Diethylether extrahiert.

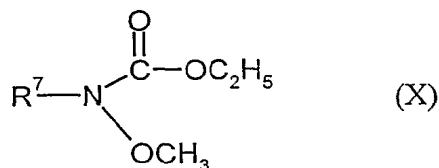
- 5 Die verbleibende wässrige Phase wird unter vermindertem Druck zur Trockne eingengt und dreimal mit je 10 ml Methanol versetzt. Nach Entfernen des Methanols unter vermindertem Druck werden 310 mg an (1-Trifluormethyl-prop-2-en)-amin-hydrochlorid isoliert. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 82,9 % der Theorie.

10

Nach den zuvor angegebenen Methoden lassen sich auch die in den folgenden Tabellen angegebenen Carbamate herstellen.

Tabelle 2

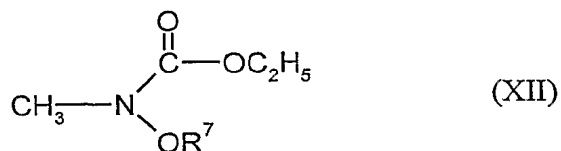
15



Beispiel-Nr.	Verb.-Nr.	R ⁷	logP
824	X-2	$\begin{array}{c} \text{CH}_3-\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	2,38
825	X-3	$\begin{array}{c} \text{CH}_2=\text{C}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	2,06

- 123 -

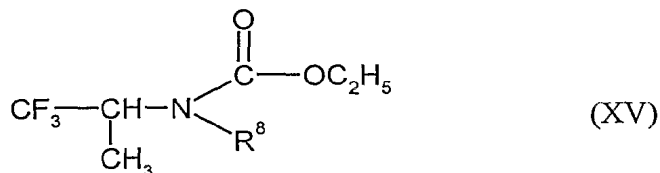
Tabelle 3



Beispiel-Nr.	Verb.-Nr.	R ⁷	Physikalische Konst.
826	XII-2	$\begin{array}{c} \text{CH}_2=\text{C}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	

5

Tabelle 4

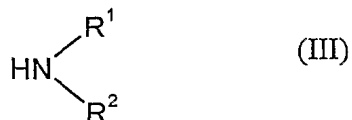


Beispiel-Nr.	Verb.-Nr.	R ⁸	Physikalische Konst.
827	XV-2	-C ₂ H ₅	¹ H-NMR (400 MHz, CD ₃ CN): δ (ppm) = 1,13 (t, <u>CH</u> ₃ CH ₂ N), 1,21 (t, <u>CH</u> ₃ CHCF ₃), 1,23 (t, <u>CH</u> ₃ CH ₂ O), 3,20 (m, <u>CH</u> ₂ N, <u>CH</u> CF ₃), 4,1 (q, CH ₃ <u>CH</u> ₂ O).

10

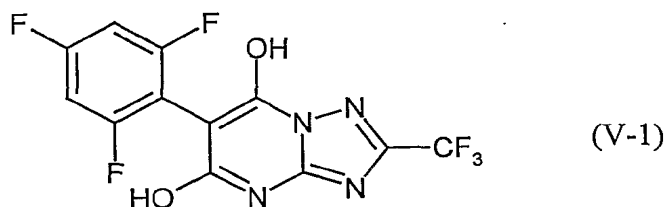
Nach den zuvor angegebenen Methoden lassen sich auch die in der folgenden Tabelle aufgeführten Amine herstellen.

Tabelle 5



Beispiel-Nr.	Verb.-Nr.	R ¹	R ²	Physikal. Konst.
828	III-5	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH} - \text{CH}_2 - \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	-OCH ₃	¹ H-NMR (400 MHz, CD ₃ CN): δ (ppm) = 1,03 (d, <u>CH</u> ₃) ₂ CH), 3,06 (d, <u>CH</u> ₂), 3,28 (b, (CH ₃) ₂ <u>CH</u>), 4,01 (s, OCH ₃)
829	III-6	$\begin{array}{c} \text{CH}_2 = \text{C} - \text{CH}_2 - \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	-OCH ₃	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO): δ (ppm) = 1,76 (s, <u>CH</u> ₃ (CCH ₂)CH ₂), 3,29 (b, NH, CH ₃ (CCH ₂) <u>CH</u> ₂ , OCH ₃), 7,89, 5,02 (2 s, CH ₃ (CCH ₂)CH ₂).
830	III-7	$\begin{array}{c} \text{CH}_2 = \text{C} - \text{CH}_2 - \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$		
831	III-8	$\begin{array}{c} \text{CF}_3 - \text{CH} - \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	-C ₂ H ₅	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO): δ (ppm) = 1,06 (m, <u>CH</u> ₃ CH ₂ N, <u>CH</u> ₃ CHCF ₃), 3,20 (m, <u>CH</u> ₂ N), 4,1 (m, <u>CH</u> CF ₃).

- 5 Die in den Beispielen 828 bis 831 aufgeführten Amine wurden jeweils in Form ihrer Hydrochloride isoliert und charakterisiert.

Beispiel 832

- 5 10,1 g (38,5 mmol) 2-(2,4,6-trifluor-phenyl)malonsäuredimethylester und 5,85 g
(38,5 mmol) 5-Trifluormethyl-1H-[1,2,4]triazol-3-ylamin werden in 10,1 ml Tri-n-
Butylamin 6 Stunden auf 180°C erhitzt, wobei entstehendes Methanol abdestilliert
wird. Das Tri-n-Butylamin wird unter stark vermindertem Druck abdestilliert. Man
erhält 17,8 g rohes 2-Trifluormethyl-6-(2,4,6-trifluor-phenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]-
10 pyrimidin-5,7-diol, das ohne Reinigung weiter umgesetzt wird.

HPLC: logP = 0,81

- 126 -

Beispiel A

Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

- 5 Lösungsmittel: 25 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid
Emulgator: 0,6 Gewichtsteile Alkylarylpolglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1
Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator
und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der
Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach
Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidiensuspension
von Puccinia recondita besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und
100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

20 Die Pflanzen werden dann in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C
und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 80 % aufgestellt, um die Entwicklung von
Rostpusteln zu begünstigen.

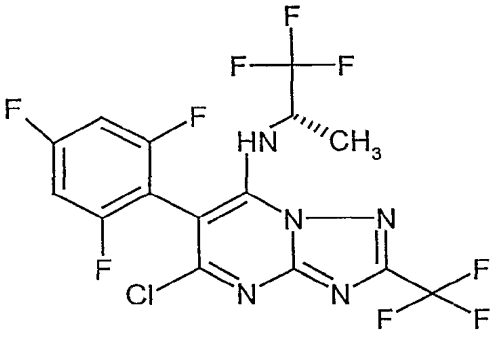
25 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein
Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad
von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden
Tabelle hervor.

- 127 -

Tabelle A

Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<div>Erfindungsgemäß</div> <div>Chiral</div> <div> (3)</div>	500	100

Beispiel B

Podospaera-Test (Apfel) / protektiv

- 5 Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton
 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykolether

- 10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1
Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator
und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

- 15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der
Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach
Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen
Sporensuspension des Apfelmehltauereegers *Podospaera leucotricha* inokuliert.
Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 23°C und einer relativen
Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % aufgestellt.

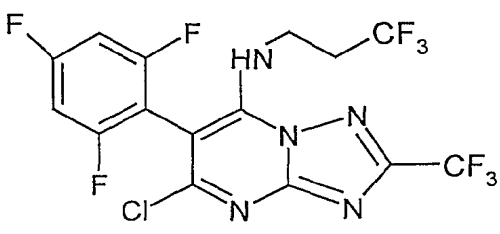
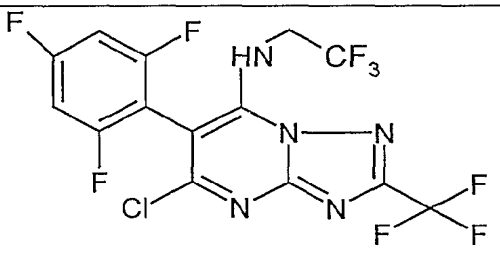
- 20 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein
Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad
von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

- 25 Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden
Tabelle hervor.

- 129 -

Tabelle B

Podospaera-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
Erfindungsgemäß  (7)	100	100
 (8)	100	100

Beispiel C

Spaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

- 5 Lösungsmittel: 49 Gewichtsteile N,N-Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1
Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator
und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Gurkenpflanzen mit der
Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der
Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Sphaerotheca*
fuliginea inokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei
70 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 23°C aufgestellt.

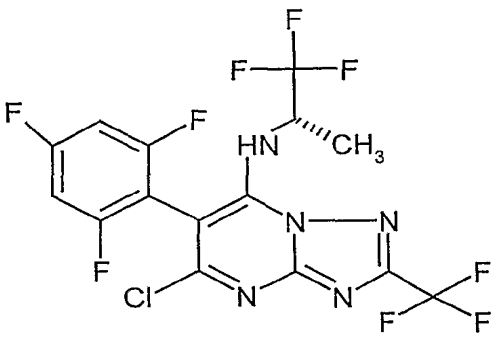
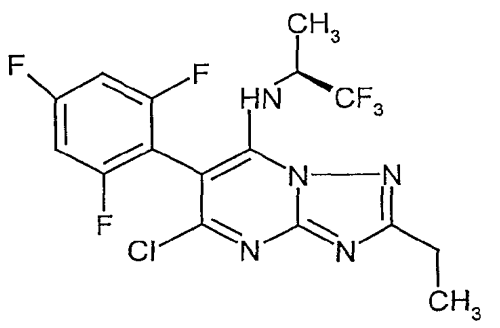
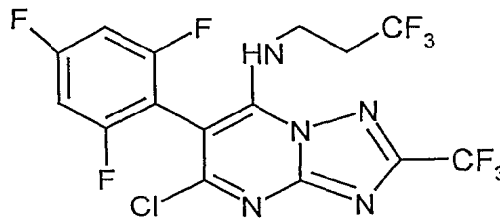
20 7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein
Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad
von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden
Tabelle hervor.

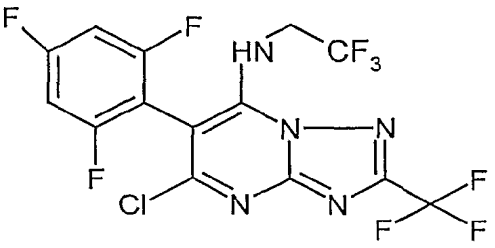
- 131 -

Tabelle C

Spaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

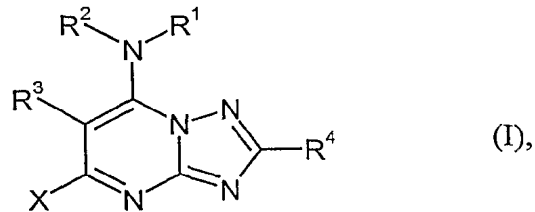
Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
Erfindungsgemäß: <div style="text-align: right;">Chiral</div>  <div style="text-align: right;">(3)</div>	750	93
 <div style="text-align: right;">(4)</div>	750	93
 <div style="text-align: right;">(7)</div>	750	100

- 132 -

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
 (8)	750	100

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

R¹ für Amino, Hydroxy, für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Alkenyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkinyloxy, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkylamino, gegebenenfalls substituiertes Dialkylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkenylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkynylamino, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkylamino, gegebenenfalls substituiertes N-Cycloalkyl-N-alkyl-amino, gegebenenfalls substituiertes Alkylidenamino, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl oder für einen Rest der Formel -S-R⁵ steht, worin

R⁵ für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht,

- 134 -

R² für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht,

5 oder

R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen,

10 R³ für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Aryl steht,

R⁴ für gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder für gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht und

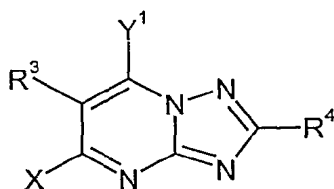
15 X für Halogen steht,

sowie Säure-Additionssalze von denjenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

20 R¹ für Amino steht.

2. Verfahren zur Herstellung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

25 a) Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel



(II)

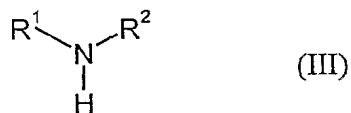
- 135 -

in welcher

R^3 , R^4 und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

5 Y^1 für Halogen steht,

mit Aminen der Formel



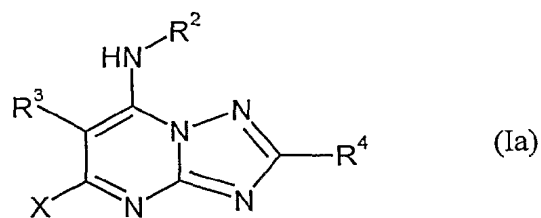
10 in welcher

R^1 und R^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegeben-
 15 nenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt,

oder

20 b) Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

R^2 , R^3 , R^4 und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

- 136 -

mit Sulfensäurehalogeniden der Formel



in welcher

5

R^5 die oben angegebenen Bedeutungen hat und

Y^2 für Halogen steht,

10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt,

und gegebenenfalls an die so erhaltenen Verbindungen der Formel (I), in denen

15

R^1 für Amino steht,

eine Säure addiert.

20

3. Mittel zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Triazolopyrimidin der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. an einem Säureadditions-Salz davon neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

25

4. Verwendung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. von deren Säureadditions-Salzen zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

30

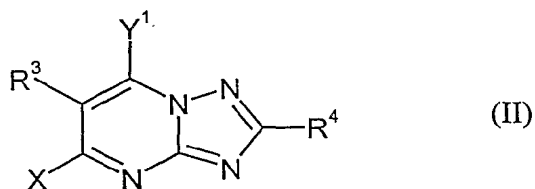
5. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch

- 137 -

1 bzw. deren Säureadditions-Salze auf die unerwünschten Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.

- 5 6. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. deren Säureadditions-Salze mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

7. Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel



10

in welcher

R³, R⁴ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

15

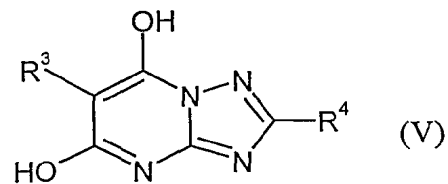
Y¹ für Halogen steht.

8. Verfahren zur Herstellung von Dihalogen-triazolopyrimidinen der Formel (II) gemäß Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass man

20

(c) Dihydroxy-triazolopyrimidine der Formel

- 138 -



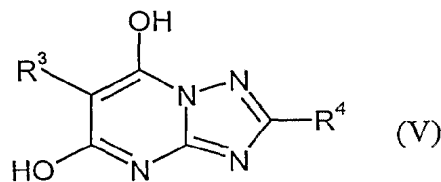
in welcher

R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

9. Dihydroxy-triazolopyrimidine der Formel



10

in welcher

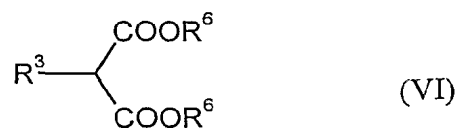
R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben.

10. Verfahren zur Herstellung von Dihydroxy-triazolopyrimidinen der Formel (V)

15

gemäß Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, dass man

d) Arylmalonester der Formel



20

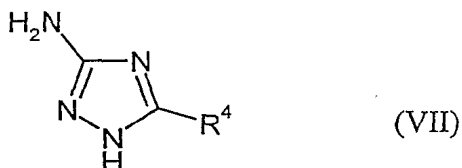
in welcher

- 139 -

R^3 die oben angegebenen Bedeutungen hat und

R^6 für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

5 mit Aminotriazolen der Formel

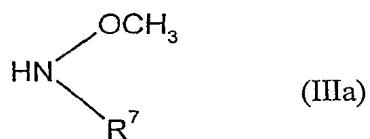


in welcher

10 R^4 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt.

15 11. Amine der Formel (IIIa),



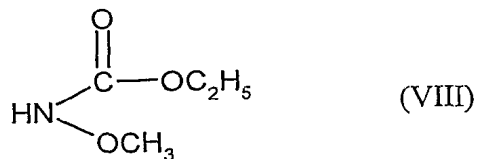
in welcher

20 R^7 für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für $\text{—CH}_2\text{—C(CH}_3\text{)=CH}_2$ steht.

12. Verfahren zur Herstellung von Aminen der Formel (IIIa) gemäß Anspruch 11, dadurch gekennzeichnet, dass man

- 140 -

- e) in einer ersten Stufe N-Methoxycarbaminsäure-ethylester der Formel (VIII)



5 mit Halogenverbindungen der Formel (IX),



in welcher

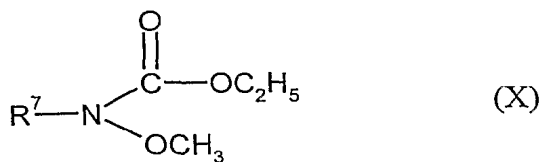
10

R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X^1 für Brom oder Iod steht,

15

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die entstehenden Carbamate der Formel (X),



in welcher

20

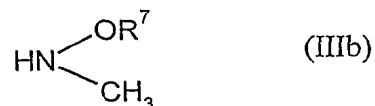
R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umgesetzt.

25

- 141 -

13. Amine der Formel (IIIb),



5

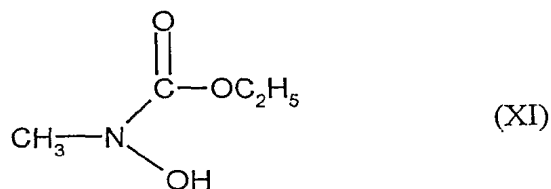
in welcher

R^7 für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für $\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---C=CH}_2 \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$ steht.

14. Verfahren zur Herstellung von Aminen der Formel (IIIb) gemäß Anspruch 13, dadurch gekennzeichnet, dass man

10

f) in einer ersten Stufe N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XI)



15

mit Halogenverbindungen der Formel (IX),



in welcher

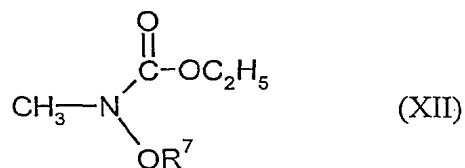
20

R^7 und X^1 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die entstehenden Carbamate der Formel (XII),

25

- 142 -



in welcher

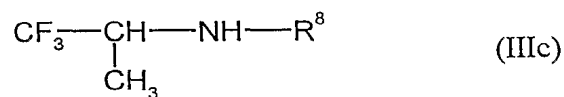
R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

5

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umgesetzt.

15. Trifluorisopropylamine der Formel (IIIc),

10



in welcher

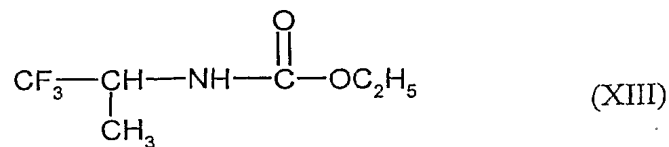
R^8 für Methyl, Ethyl oder Propyl steht.

15

16. Verfahren zur Herstellung von Trifluorisopropylaminen der Formel (IIIc) gemäß Anspruch 15, dadurch gekennzeichnet, dass man

20

g) in einer ersten Stufe N-Trifluorisopropyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XIII)



mit Halogenverbindungen der Formel (XIV),

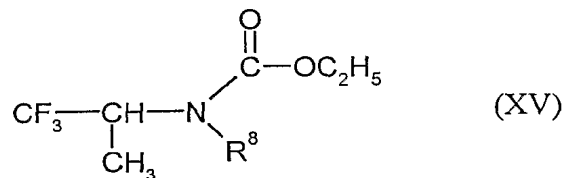
- 143 -



in welcher

5 R^8 und X^1 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels
umsetzt und die entstehenden Carbamate der Formel (XV),



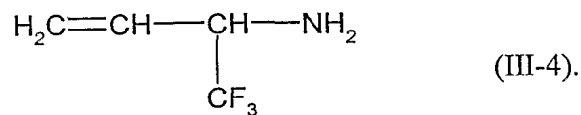
10

in welcher

R^8 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

15 in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol
und Wasser umsetzt.

17. 3-Trifluor-methyl-3-amino-propen der Formel (III-4)

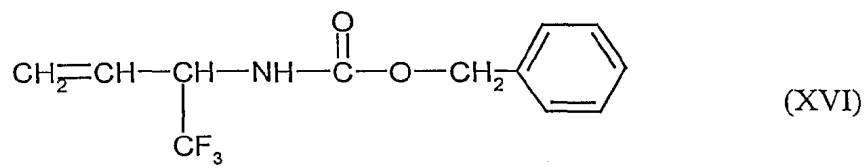


20

18. Verfahren zur Herstellung von 3-Trifluormethyl-3-amino-propen der Formel
(III-4) gemäß Anspruch 17, dadurch gekennzeichnet, dass man

25 h) das Carbatat der Formel (XVI)

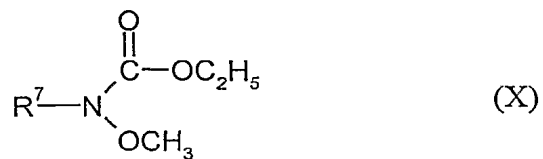
- 144 -



mit wässriger Salzsäure umgesetzt.

- 145 -

19. Carbamate der Formel (X),

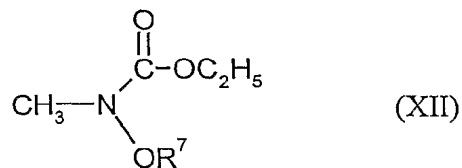


in welcher

5

R^7 für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für $-\text{CH}_2-\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}=\text{CH}_2$ steht.

20. Carbamate der Formel (XII),

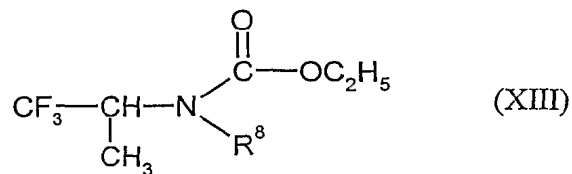


10

in welcher

R^7 für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für $-\text{CH}_2-\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}=\text{CH}_2$ steht.

15 21. Carbamate der Formel (XIII),



in welcher

20 R^8 für Methyl, Ethyl oder Propyl steht.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 02/04287

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D487/04 A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO) 8 April 1998 (1998-04-08) claim 1	1-21
Y	WERMUTH ET AL: "The Practise of Medicinal Chemistry", PRACTICE OF MEDICINAL CHEMISTRY, XX, XX, PAGE(S) 203-237 XP002190259 the whole document	1-21
Y	EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH) 7 July 1993 (1993-07-07) claim 1	1-21
Y	EP 0 613 900 A (SHELL INT RESEARCH) 7 September 1994 (1994-09-07) claim 1	1-21
	--- -/--	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

° Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- * & * document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 August 2002

Date of mailing of the international search report

03/09/2002

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Baston, E

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 02/04287

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	FR 2 784 991 A (AMERICAN CYANAMID CO) 28 April 2000 (2000-04-28) claim 1 ---	1-21
Y	FR 2 765 875 A (AMERICAN CYANAMID CO) 15 January 1999 (1999-01-15) claim 1 ---	1-21
Y	GB 2 355 261 A (AMERICAN CYANAMID CO) 18 April 2001 (2001-04-18) claim 1 ---	1-21
Y	WO 98 46607 A (AMERICAN CYANAMID CO) 22 October 1998 (1998-10-22) claim 1 ---	1-21
Y	WO 98 46608 A (AMERICAN CYANAMID CO) 22 October 1998 (1998-10-22) claim 1 ---	1-21
A	US 5 612 345 A (BECHER HEINZ-MANFRED ET AL) 18 March 1997 (1997-03-18) claim 1 ---	7,8
A	US 5 854 252 A (PEES KLAUS-JURGEN ET AL) 29 December 1998 (1998-12-29) claim 1 ---	7,8
A	WO 00 09508 A (BAYER AGROCHEM KK ; SAWADA HARUKO (JP); ISHIKAWA KOICHI (JP); KINBA) 24 February 2000 (2000-02-24) claim 1 -----	7,8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/04287

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0834513	A	08-04-1998	US 5817663 A	06-10-1998
			AT 221069 T	15-08-2002
			EP 0834513 A2	08-04-1998
			JP 10152489 A	09-06-1998
			US 5965561 A	12-10-1999
EP 0550113	A	07-07-1993	EP 0550113 A2	07-07-1993
			EP 0782997 A2	09-07-1997
			GR 3033916 T3	30-11-2000
			AT 159256 T	15-11-1997
			AT 192154 T	15-05-2000
			AU 667204 B2	14-03-1996
			AU 3043592 A	01-07-1993
			BR 9205172 A	06-07-1993
			CA 2086404 A1	01-07-1993
			CN 1075144 A ,B	11-08-1993
			CN 1141119 A ,B	29-01-1997
			DE 69222746 D1	20-11-1997
			DE 69222746 T2	12-02-1998
			DE 69230977 D1	31-05-2000
			DE 69230977 T2	09-11-2000
			DK 550113 T3	09-02-1998
			DK 782997 T3	07-08-2000
			ES 2108727 T3	01-01-1998
			ES 2147411 T3	01-09-2000
			GR 3025920 T3	30-04-1998
			HK 1010105 A1	23-06-2000
			HU 217349 B	28-01-2000
			IL 104244 A	13-07-1997
			JP 5271234 A	19-10-1993
			NZ 245581 A	26-07-1995
			PL 297160 A1	06-09-1993
			PL 171579 B1	30-05-1997
			PT 782997 T	29-09-2000
			RU 2089552 C1	10-09-1997
			SG 47563 A1	17-04-1998
			US 5593996 A	14-01-1997
			ZA 9210043 A	28-07-1993
EP 0613900	A	07-09-1994	EP 0613900 A1	07-09-1994
			AT 153025 T	15-05-1997
			AU 672267 B2	26-09-1996
			AU 5633294 A	08-09-1994
			BG 61647 B1	27-02-1998
			BG 98637 A	31-01-1995
			BR 9400808 A	01-11-1994
			CA 2116946 A1	05-09-1994
			CN 1094407 A	02-11-1994
			DE 69403119 D1	19-06-1997
			DE 69403119 T2	28-08-1997
			DK 613900 T3	23-06-1997
			ES 2101429 T3	01-07-1997
			GR 3023587 T3	29-08-1997
			HK 1001054 A1	22-05-1998
			HU 68050 A2	29-05-1995
			IL 108731 A	18-03-1997
			JP 7002861 A	06-01-1995
			NZ 250955 A	27-04-1995

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/04287

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0613900	A		OA 9891 A	15-09-1994
			RO 112869 B1	30-01-1998
			RU 2126408 C1	20-02-1999
			SG 48897 A1	18-05-1998
			US 5756509 A	26-05-1998
			ZA 9401484 A	10-11-1994
FR 2784991	A	28-04-2000	FR 2784991 A1	28-04-2000
FR 2765875	A	15-01-1999	FR 2765875 A1	15-01-1999
			JP 11035581 A	09-02-1999
GB 2355261	A	18-04-2001	NONE	
WO 9846607	A	22-10-1998	AT 202779 T	15-07-2001
			AU 6576898 A	11-11-1998
			DE 69801048 D1	09-08-2001
			DE 69801048 T2	14-03-2002
			DK 975634 T3	24-09-2001
			EP 0975634 A1	02-02-2000
			ES 2160408 T3	01-11-2001
			PT 975634 T	28-12-2001
			WO 9846607 A1	22-10-1998
			ZA 9803055 A	11-10-1999
WO 9846608	A	22-10-1998	AU 735730 B2	12-07-2001
			AU 6867198 A	11-11-1998
			BG 103805 A	30-06-2000
			BR 9808531 A	23-05-2000
			CN 1257502 T	21-06-2000
			EE 9900486 A	15-06-2000
			EP 0975635 A1	02-02-2000
			HU 0001993 A2	28-10-2000
			JP 2001520650 T	30-10-2001
			NO 994973 A	13-10-1999
			NZ 500143 A	29-06-2001
			PL 336164 A1	05-06-2000
			SK 141499 A3	11-09-2001
			TR 9902552 T2	22-05-2000
			TW 460476 B	21-10-2001
			WO 9846608 A1	22-10-1998
			ZA 9803054 A	11-10-1999
US 5612345	A	18-03-1997	NONE	
US 5854252	A	29-12-1998	AT 159722 T	15-11-1997
			AU 690899 B2	07-05-1998
			AU 6258094 A	26-09-1994
			BR 9405988 A	26-12-1995
			CA 2157293 A1	15-09-1994
			CN 1119015 A , B	20-03-1996
			CZ 9502233 A3	17-01-1996
			DE 69406538 D1	04-12-1997
			DK 699200 T3	20-07-1998
			WO 9420501 A1	15-09-1994
			EP 0699200 A1	06-03-1996
			HK 1004332 A1	20-11-1998
			HU 73163 A2	28-06-1996

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/04287

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5854252	A	IL 108747 A	12-03-1999
		JP 8507505 T	13-08-1996
		NZ 262729 A	26-01-1996
		PL 310467 A1	11-12-1995
		RU 2130459 C1	20-05-1999
		SG 48860 A1	18-05-1998
		SK 106895 A3	05-06-1996
		ZA 9401485 A	10-11-1994
WO 0009508	A	JP 2000119274 A	25-04-2000
	24-02-2000	AU 5061099 A	06-03-2000
		WO 0009508 A1	24-02-2000

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D487/04 A01N43/90

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO) 8. April 1998 (1998-04-08) Anspruch 1 ---	1-21
Y	WERMUTH ET AL: "The Practise of Medicinal Chemistry", PRACTICE OF MEDICINAL CHEMISTRY, XX, XX, PAGE(S) 203-237 XP002190259 das ganze Dokument ---	1-21
Y	EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH) 7. Juli 1993 (1993-07-07) Anspruch 1 ---	1-21
Y	EP 0 613 900 A (SHELL INT RESEARCH) 7. September 1994 (1994-09-07) Anspruch 1 ---	1-21
	--- -/--	

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

27. August 2002

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

03/09/2002

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Baston, E

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Beitr. Anspruch Nr.
Y	FR 2 784 991 A (AMERICAN CYANAMID CO) 28. April 2000 (2000-04-28) Anspruch 1 ---	1-21
Y	FR 2 765 875 A (AMERICAN CYANAMID CO) 15. Januar 1999 (1999-01-15) Anspruch 1 ---	1-21
Y	GB 2 355 261 A (AMERICAN CYANAMID CO) 18. April 2001 (2001-04-18) Anspruch 1 ---	1-21
Y	WO 98 46607 A (AMERICAN CYANAMID CO) 22. Oktober 1998 (1998-10-22) Anspruch 1 ---	1-21
Y	WO 98 46608 A (AMERICAN CYANAMID CO) 22. Oktober 1998 (1998-10-22) Anspruch 1 ---	1-21
A	US 5 612 345 A (BECHER HEINZ-MANFRED ET AL) 18. März 1997 (1997-03-18) Anspruch 1 ---	7,8
A	US 5 854 252 A (PEES KLAUS-JURGEN ET AL) 29. Dezember 1998 (1998-12-29) Anspruch 1 ---	7,8
A	WO 00 09508 A (BAYER AGROCHEM KK ; SAWADA HARUKO (JP); ISHIKAWA KOICHI (JP); KINBA) 24. Februar 2000 (2000-02-24) Anspruch 1 -----	7,8

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/04287

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0834513 A	08-04-1998	US 5817663 A	06-10-1998
		AT 221069 T	15-08-2002
		EP 0834513 A2	08-04-1998
		JP 10152489 A	09-06-1998
		US 5965561 A	12-10-1999
EP 0550113 A	07-07-1993	EP 0550113 A2	07-07-1993
		EP 0782997 A2	09-07-1997
		GR 3033916 T3	30-11-2000
		AT 159256 T	15-11-1997
		AT 192154 T	15-05-2000
		AU 667204 B2	14-03-1996
		AU 3043592 A	01-07-1993
		BR 9205172 A	06-07-1993
		CA 2086404 A1	01-07-1993
		CN 1075144 A , B	11-08-1993
		CN 1141119 A , B	29-01-1997
		DE 69222746 D1	20-11-1997
		DE 69222746 T2	12-02-1998
		DE 69230977 D1	31-05-2000
		DE 69230977 T2	09-11-2000
		DK 550113 T3	09-02-1998
		DK 782997 T3	07-08-2000
		ES 2108727 T3	01-01-1998
		ES 2147411 T3	01-09-2000
		GR 3025920 T3	30-04-1998
		HK 1010105 A1	23-06-2000
		HU 217349 B	28-01-2000
		IL 104244 A	13-07-1997
		JP 5271234 A	19-10-1993
		NZ 245581 A	26-07-1995
		PL 297160 A1	06-09-1993
		PL 171579 B1	30-05-1997
		PT 782997 T	29-09-2000
		RU 2089552 C1	10-09-1997
		SG 47563 A1	17-04-1998
		US 5593996 A	14-01-1997
		ZA 9210043 A	28-07-1993
EP 0613900 A	07-09-1994	EP 0613900 A1	07-09-1994
		AT 153025 T	15-05-1997
		AU 672267 B2	26-09-1996
		AU 5633294 A	08-09-1994
		BG 61647 B1	27-02-1998
		BG 98637 A	31-01-1995
		BR 9400808 A	01-11-1994
		CA 2116946 A1	05-09-1994
		CN 1094407 A	02-11-1994
		DE 69403119 D1	19-06-1997
		DE 69403119 T2	28-08-1997
		DK 613900 T3	23-06-1997
		ES 2101429 T3	01-07-1997
		GR 3023587 T3	29-08-1997
		HK 1001054 A1	22-05-1998
		HU 68050 A2	29-05-1995
		IL 108731 A	18-03-1997
		JP 7002861 A	06-01-1995
		NZ 250955 A	27-04-1995

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/04287

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0613900 A		OA 9891 A	15-09-1994
		RO 112869 B1	30-01-1998
		RU 2126408 C1	20-02-1999
		SG 48897 A1	18-05-1998
		US 5756509 A	26-05-1998
		ZA 9401484 A	10-11-1994
FR 2784991 A	28-04-2000	FR 2784991 A1	28-04-2000
FR 2765875 A	15-01-1999	FR 2765875 A1	15-01-1999
		JP 11035581 A	09-02-1999
GB 2355261 A	18-04-2001	KEINE	
WO 9846607 A	22-10-1998	AT 202779 T	15-07-2001
		AU 6576898 A	11-11-1998
		DE 69801048 D1	09-08-2001
		DE 69801048 T2	14-03-2002
		DK 975634 T3	24-09-2001
		EP 0975634 A1	02-02-2000
		ES 2160408 T3	01-11-2001
		PT 975634 T	28-12-2001
		WO 9846607 A1	22-10-1998
		ZA 9803055 A	11-10-1999
WO 9846608 A	22-10-1998	AU 735730 B2	12-07-2001
		AU 6867198 A	11-11-1998
		BG 103805 A	30-06-2000
		BR 9808531 A	23-05-2000
		CN 1257502 T	21-06-2000
		EE 9900486 A	15-06-2000
		EP 0975635 A1	02-02-2000
		HU 0001993 A2	28-10-2000
		JP 2001520650 T	30-10-2001
		NO 994973 A	13-10-1999
		NZ 500143 A	29-06-2001
		PL 336164 A1	05-06-2000
		SK 141499 A3	11-09-2001
		TR 9902552 T2	22-05-2000
		TW 460476 B	21-10-2001
		WO 9846608 A1	22-10-1998
		ZA 9803054 A	11-10-1999
US 5612345 A	18-03-1997	KEINE	
US 5854252 A	29-12-1998	AT 159722 T	15-11-1997
		AU 690899 B2	07-05-1998
		AU 6258094 A	26-09-1994
		BR 9405988 A	26-12-1995
		CA 2157293 A1	15-09-1994
		CN 1119015 A ,B	20-03-1996
		CZ 9502233 A3	17-01-1996
		DE 69406538 D1	04-12-1997
		DK 699200 T3	20-07-1998
		WO 9420501 A1	15-09-1994
		EP 0699200 A1	06-03-1996
		HK 1004332 A1	20-11-1998
		HU 73163 A2	28-06-1996

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/04287

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 5854252	A	IL 108747 A	12-03-1999
		JP 8507505 T	13-08-1996
		NZ 262729 A	26-01-1996
		PL 310467 A1	11-12-1995
		RU 2130459 C1	20-05-1999
		SG 48860 A1	18-05-1998
		SK 106895 A3	05-06-1996
		ZA 9401485 A	10-11-1994
<hr/>			
WO 0009508	A	JP 2000119274 A	25-04-2000
		AU 5061099 A	06-03-2000
		WO 0009508 A1	24-02-2000
<hr/>			